

This Page Is Inserted by IFW Operations  
and is not a part of the Official Record

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning documents *will not* correct images,  
please do not report the images to the  
Image Problem Mailbox.**

## PATENT COOPERATION TREATY

PCT

## NOTIFICATION OF ELECTION

(PCT Rule 61.2)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

Assistant Commissioner for Patents  
United States Patent and Trademark  
Office  
Box PCT  
Washington, D.C.20231  
ETATS-UNIS D'AMERIQUE

in its capacity as elected Office

Date of mailing (day/month/year)

26 July 2000 (26.07.00)

International application No.

PCT/EP99/09413

Applicant's or agent's file reference

0050/050555

International filing date (day/month/year)

02 December 1999 (02.12.99)

Priority date (day/month/year)

04 December 1998 (04.12.98)

Applicant

NEIDLEIN, Ulf et al

1. The designated Office is hereby notified of its election made:



in the demand filed with the International Preliminary Examining Authority on:

28 June 2000 (28.06.00)



in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:

2. The election ☒ was

was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

The International Bureau of WIPO  
34, chemin des Colombettes  
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Charlotte ENGER

Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

Telephone No.: (41-22) 338.83.38

# VERTRAG FÜR DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

### INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>0050/050555</b>	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5	
Internationales Aktenzeichen <b>PCT/EP 99/ 09413</b>	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) <b>02/12/1999</b>	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) <b>04/12/1998</b>
Anmelder  <b>BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al</b>		

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 3 Blätter.

☒ Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

#### 1. Grundlage des Berichts

a. Hinsichtlich der **Sprache** ist die internationale Recherche auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache durchgeführt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

☐ Die internationale Recherche ist auf der Grundlage einer bei der Behörde eingereichten Übersetzung der internationalen Anmeldung (Regel 23.1 b)) durchgeführt worden.

b. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale Recherche auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das

☐ in der internationalen Anmeldung in Schriftlicher Form enthalten ist.

☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.

☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.

☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfaßten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

2. ☐ Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen (siehe Feld I).

3. ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung (siehe Feld II).

#### 4. Hinsichtlich der Bezeichnung der Erfindung

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

☐ wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt:

#### 5. Hinsichtlich der Zusammenfassung

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

☐ wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der in Feld III angegebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Behörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

#### 6. Folgende Abbildung der Zeichnungen ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen: Abb. Nr. ---

☐ wie vom Anmelder vorgeschlagen

☐ weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.

☐ weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.

☐ keine der Abb.

**A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES**

IPK 7 C07D413/10 C07D231/20 A01N43/74 A01N43/50

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

**B. RECHERCHIERTE GEBIETE**

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, PAJ

**C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN**

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 96 26206 A (BASF AG ; DEYN WOLFGANG VON (DE); HILL REGINA LUISE (DE); KARDORFF) 29. August 1996 (1996-08-29) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche Seite 39 -Seite 40; Beispiele; Tabelle 5 ---	1,8,10, 11
X	WO 98 31681 A (BASF AG) 23. Juli 1998 (1998-07-23) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche Seite 120 -Seite 129; Beispiele; Tabelle 3 & WO 98 31682 A (BASF AG) 23. Juli 1998 (1998-07-23) Beispiele ---	1,8,10, 11
X	---	1,8,10, 11
	--- -/-	

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung befragt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&amp;" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

14. August 2000

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

25/08/2000

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Paisdor, B

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P, X	WO 99 23094 A (TAKAHASHI AKIHIRO ;ADACHI HIROYUKI (JP); KOGUCHI MASAMI (JP); NIPP) 14. Mai 1999 (1999-05-14) Zusammenfassung Seite 21 -Seite 23; Tabelle Seite 24 -Seite 28 Seite 29 -Seite 35; Tabellen -----	1,8,10, 11

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 99/09413

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9626206	A	29-08-1996	AU 710172 B	16-09-1999
			AU 4665596 A	11-09-1996
			BG 101825 A	30-04-1998
			BR 9607333 A	25-11-1997
			CA 2210693 A	29-08-1996
			CN 1175951 A	11-03-1998
			CZ 9702473 A	13-05-1998
			EP 0811007 A	10-12-1997
			FI 973471 A	22-08-1997
			HU 9800725 A	28-07-1998
			JP 11500438 T	12-01-1999
			LT 97145 A, B	26-01-1998
			LV 11895 A	20-12-1997
			LV 11895 B	20-03-1998
			NO 973861 A	22-10-1997
			NZ 301272 A	25-02-1999
			PL 322277 A	19-01-1998
			SK 104297 A	08-07-1998
			US 5846907 A	08-12-1998
WO 9831681	A	23-07-1998	AU 6092998 A	07-08-1998
			AU 6207698 A	07-08-1998
			AU 6613398 A	07-08-1998
			CN 1248255 T	22-03-2000
			CN 1250447 T	12-04-2000
			WO 9831676 A	23-07-1998
			WO 9831682 A	23-07-1998
			EP 0966452 A	29-12-1999
			EP 0958291 A	24-11-1999
			EP 0958292 A	24-11-1999
			NO 993521 A	15-09-1999
			NO 993522 A	16-09-1999
			PL 334847 A	27-03-2000
			PL 334849 A	27-03-2000
			SK 90399 A	10-12-1999
			SK 91999 A	18-01-2000
WO 9923094	A	14-05-1999	AU 9650598 A	24-05-1999
			JP 11240872 A	07-09-1999

09/857067  
Translation  
5630

1616  
PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

10

Applicant's or agent's file reference 0050/050555	<b>FOR FURTHER ACTION</b> See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP99/09413	International filing date (day/month/year) 02 December 1999 (02.12.99)	Priority date (day/month/year) 04 December 1998 (04.12.98)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 413/10		<b>RECEIVED</b> NOV 23 2001
Applicant BASF AKTIENGESELLSCHAFT		TECH CENTER 1600/2900

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 8 sheets, including this cover sheet.  
☐ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).  
These annexes consist of a total of \_\_\_\_\_ sheets.
3. This report contains indications relating to the following items:
  - I ☒ Basis of the report
  - II ☐ Priority
  - III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
  - IV ☒ Lack of unity of invention
  - V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
  - VI ☒ Certain documents cited
  - VII ☐ Certain defects in the international application
  - VIII ☒ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 28 June 2000 (28.06.00)	Date of completion of this report 27 March 2001 (27.03.2001)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP99/09413

## I. Basis of the report

## 1. With regard to the elements of the international application:\*

- ☐ the international application as originally filed
- ☒ the description:  
pages \_\_\_\_\_ 1-47 \_\_\_\_\_, as originally filed  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_
- ☒ the claims:  
pages \_\_\_\_\_ 1-13 \_\_\_\_\_, as originally filed  
pages \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement under Article 19  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings:  
pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing part of the description:  
pages \_\_\_\_\_, as originally filed  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand  
pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_

## 2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language \_\_\_\_\_ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

## 3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/fig \_\_\_\_\_

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).\*\*

\* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

\*\* Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.



# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP99/09413

## IV. Lack of unity of invention

1. In response to the invitation to restrict or pay additional fees the applicant has:

- ☐ restricted the claims.
- ☐ paid additional fees.
- ☐ paid additional fees under protest.
- ☐ neither restricted nor paid additional fees.

2. ☒ This Authority found that the requirement of unity of invention is not complied with and chose, according to Rule 68.1, not to invite the applicant to restrict or pay additional fees.

3. This Authority considers that the requirement of unity of invention in accordance with Rules 13.1, 13.2 and 13.3 is

- ☐ complied with.
- ☒ not complied with for the following reasons:

See annex

4. Consequently, the following parts of the international application were the subject of international preliminary examination in establishing this report:

- ☒ all parts.
- ☐ the parts relating to claims Nos. \_\_\_\_\_

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 99/09413

**Supplemental Box**

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: BOX IV.3

**Claims 8 and 9** should be deleted from the present application, since it is not possible to recognise any inventive concept linking the compounds in these claims to the remaining subject matter of the application (PCT Rule 13.1), as explained below.

**Claims 1-7 and 10-14** are linked by the compounds of Formula I, which in turn contain as common distinguishing feature the branching of the alkyl group at N-1. This distinguishing feature is missing in the compounds as per Claims 8 and 9.

**Moreover, it is noted that the compounds of Formulae (III) and (V) as per Claims 8 and 9 are not only intended for producing the compounds of Formula (I), but can also be used for producing prior art compounds containing, for example, another alkyl group at N-1, as in D2, since the distinguishing feature, as already explained, is missing in Formulae (III) and (V). Consequently, the objection to this application for lack of unity of invention is upheld.**

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 99/09413

## V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability: citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)	Claims		YES
	Claims	8	NO
Inventive step (IS)	Claims	1-7, 10-13	YES
	Claims	8, 9	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-13	YES
	Claims		NO

## 2. Citations and explanations

1. Prior art documents

This report makes reference to the following documents:

D1: WO-A-96/26206 (BASF AG)

D2: WO-A-98/31681 (BASF AG) & WO-A-98/31682  
(BASF AG)

D3: WO-A-99/23094 (NIPPON SODA CO. LTD.).

D1-D3 disclose benzoyl pyrazoles effective as herbicides. Regarding D3, see also Box VI.

2. Novelty (PCT Article 33(2))

The subject matter of the present **Claim 1** and its dependent **Claims 2-4** is novel over the compounds in the disclosures of D1 and D2, since none of those compounds possesses an alkyl group branched at its  $\alpha$ -C atom (directly linked to N-1) in position 1 on the pyrazole ring.

Accordingly, the methods as per **Claims 5-7**, which produce these novel compounds, and the other independent **Claims 10-13**, which also refer to said

compounds, are also novel (PCT Article 33(2)).

The subject matter of **Claim 8** is anticipated by Claim 18 of D2 and is therefore **not** novel.

**It is noted that the present Claim 8 cannot be regarded as a novel selection**, since the compounds in this claim and the analogous compounds in D2 serve the same purpose: the preparation of end products having the same basic structure by linking these compounds to the pyrazole derivative via the carbonyl function. Consequently, the present selection does not serve a special purpose and does not substantiate the novelty of said claims.

The most essential difference between the subject matter of the present **Claim 9** and D1 and D2 is the nature of the L<sup>2</sup> substituent. Claim 9 is therefore novel.

3. Inventive step (PCT Article 33(3))

The present application addresses the **technical problem** of providing alternative herbicides to the compounds disclosed in the relevant documents D1 and D2.

The **technical solution** to this problem consists in the modification of the structures specifically disclosed in D1 by replacing the alkyl substituents on the N-1 atom of the pyrazole ring by substituents which are branched at the  $\alpha$ -C atom (directly linked to N-1) (e.g. sec-C<sub>4</sub>H<sub>9</sub>), as established by the definition of radicals R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> and R<sup>10</sup> in the present Claim 1.

This modification can be considered to involve an inventive step, since the applicant could convincingly demonstrate an advantageous effect by means of the comparative data submitted with the letter of 28 February 2001: The compounds 2.2 and 2.23 of the present application thus show an enhanced herbicidal effect in comparison with the compounds 2.69 and A of D2 (with a linear alkyl substituent at the N-1 atom).

It is added that D2 mentions compounds that even possess a branch in the  $\beta$ -position to N-1 (substituents  $R^6$  and  $R^{16}$ ). However, these should not be considered the structurally closest prior art compounds, since these examples specifically disclosed in D2 contain chlorine and not methyl or another alkyl group as  $R^1$  substituent (see definition of  $R^1$  in the present Claim 1).

Claim 1 of the present application, and Claims 2-7 and 10-13, which refer to Claim 1, therefore meet the requirement of PCT Article 33(3) because they involve an inventive step.

The intermediates of Formulae (III) and (V) as per Claims 8 and 9 are not inventive *per se*, since they do not contribute the distinguishing feature, i.e. the  $\alpha$ -branched alkyl group at N-1, to the structure of the end products according to the invention.

4. Industrial applicability (PCT Article 33(4))

Claims 1-13 of the present application are industrially applicable (PCT Article 33(4)).

# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP99/09413

## VI. Certain documents cited

### 1. Certain published documents (Rule 70.10)

Application No.  
Patent No.

Publication date  
(day/month/year)

Filing date  
(day/month/year)

Priority date (valid claim)  
(day/month/year)

### 2. Non-written disclosures (Rule 70.9)

Kind of non-written disclosure

Date of non-written disclosure  
(day/month/year)

Date of written disclosure  
referring to non-written disclosure  
(day/month/year)

See annex

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.  
PCT/EP 99/09413

**Supplemental Box**

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: BOX VI

D3: WO-A-99/23094

D3 is not prior art within the meaning of PCT Rule  
64.1(b).

# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 99/09413

## VIII. Certain observations on the international application

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

**Claim 11** ("method for producing agents...") should presumably refer to Claim 10 ("agents...") and not to Claim 8.



# VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

## PCT

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT



(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0050/050555	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP99/09413	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 02/12/1999	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Tag) 04/12/1998
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D413/00		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al		

1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 8 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.  
☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).  
Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Berichts
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☒ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☒ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☒ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags  28/06/2000	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  27.03.2001
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde:   Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter  Stroeter, T  Tel. Nr. +49 89 2399 8088 

# INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP99/09413

## I. Grundlage des Berichts

1. Dieser Bericht wurde erstellt auf der Grundlage (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten.*):

### Beschreibung, Seiten:

1-47                      ursprüngliche Fassung

### Patentansprüche, Nr.:

1-13                      ursprüngliche Fassung

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung,              Seiten:
- ☐ Ansprüche,                  Nr.:
- ☐ Zeichnungen,                Blatt:

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

*(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen).*

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

**IV. Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung**

1. Auf die Aufforderung zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren hat der Anmelder:
- ☐ die Ansprüche eingeschränkt.
  - ☐ zusätzliche Gebühren entrichtet.
  - ☐ zusätzliche Gebühren unter Widerspruch entrichtet.
  - ☐ weder die Ansprüche eingeschränkt noch zusätzliche Gebühren entrichtet.
2. ☒ Die Behörde hat festgestellt, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist, und hat gemäß Regel 68.1 beschlossen, den Anmelder nicht zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren aufzufordern.
3. Die Behörde ist der Auffassung, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nach den Regeln 13.1, 13.2 und 13.3
- ☐ erfüllt ist
  - ☒ aus folgenden Gründen nicht erfüllt ist:  
**siehe Beiblatt**
4. Daher wurde zur Erstellung dieses Berichts eine internationale vorläufige Prüfung für folgende Teile der internationalen Anmeldung durchgeführt:
- ☒ alle Teile.
  - ☐ die Teile, die sich auf die Ansprüche Nr. beziehen.

**V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

1. Feststellung

Neuheit (N)

Ja: Ansprüche

Nein: Ansprüche 8

# INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP99/09413

Erfinderische Tätigkeit (ET)	Ja: Ansprüche	1-7, 10-13
	Nein: Ansprüche	8,9
Gewerbliche Anwendbarkeit (GA)	Ja: Ansprüche	1-13
	Nein: Ansprüche	

2. Unterlagen und Erklärungen  
siehe Beiblatt

## VI. Bestimmte angeführte Unterlagen

1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)

und / oder

2. Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)

siehe Beiblatt

## VIII. Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Zur Klarheit der Patentansprüche, der Beschreibung und der Zeichnungen oder zu der Frage, ob die Ansprüche in vollem Umfang durch die Beschreibung gestützt werden, ist folgendes zu bemerken:  
siehe Beiblatt

**Zu Punkt IV**

**Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung**

Die **Ansprüche 8 und 9** sollten aus der vorliegenden Anmeldung entfernt werden, da zwischen den Verbindungen aus diesen Ansprüchen und dem verbleibenden Gegenstand der Anmeldung kein verbindendes erfinderisches Konzept erkennbar ist. (Regel 13.1 PCT), wie im folgenden ausgeführt wird:

Die **Ansprüche 1 bis 7 und 10 bis 14** werden durch die Verbindungen der Formel I vereinheitlicht, welche ihrerseits als gemeinsames und vom Stand der Technik unterscheidendes Merkmal die Verzweigung der alkyliischen Gruppierung am N-1 enthalten. Dieses charakteristische Merkmal fehlt den in den Ansprüchen 8 und 9 beanspruchten Verbindungen.

**Des weiteren wird darauf hingewiesen, daß die Verbindungen der Formeln (III) und (V) aus den Ansprüchen 8 und 9 nicht nur auf die Herstellung der Verbindungen der Formel (I) ausgerichtet sind, sondern auch zur Darstellung von Verbindungen des Standes der Technik z.B. mit einer anderen alkyliischen Gruppierung am N-1 wie in D2 verwendet werden können, da das charakteristische Merkmal, wie bereits gesagt, in den Formeln (III) und (V) fehlt. Der Einwand bzgl. mangelnder Einheitlichkeit der vorliegenden Anmeldung wird daher aufrechterhalten.**

**Zu Punkt V**

**Begründete Feststellung nach Regel 66.2(a)(ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

**1 Dokumente zum Stand der Technik**

Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:

D1: WO 96 26206 A (BASF AG)

D2: WO 98 31681 A (BASF AG) & WO 98 31682 A (BASF AG)

D3: WO 99 23094 A (NIPPON SODA CO. LTD.)

D1 bis D3 offenbaren Benzoylpyrazole, welche als Herbizide wirksam sind.  
Bezüglich D3 siehe auch Punkt VI.

2 Neuheit (Artikel 33(2) PCT)

Der Gegenstand des vorliegenden **Anspruchs 1** und seiner abhängigen **Ansprüche 2 bis 4** ist neu gegenüber den Verbindungen aus den Offenbarungen D1 und D2, da in keiner dieser Verbindungen am Pyrazolring in 1-Position eine Alkylgruppe zu finden ist, die an ihrem  $\alpha$ -C-Atom (direkt an N-1 gebunden) verzweigt ist.

Demgemäß sind auch die Verfahren der **Ansprüche 5 bis 7**, welche diese neuen Verbindungen bereitstellen, sowie die weiteren unabhängigen **Ansprüche 10 bis 13**, welche sich ebenso auf besagte Verbindungen beziehen neu im Sinne von Artikel 33(2) PCT.

Der Gegenstand des **Anspruchs 8** wird durch Anspruch 18 aus D2 vorweggenommen und ist daher **nicht** neu.

**Es wird darauf hingewiesen, daß der vorliegende Anspruch 8 nicht als neuheitliche Auswahl aufgefaßt werden kann**, da sowohl die Verbindungen dieses Anspruchs wie auch die analogen Verbindungen aus D2 demselben Zweck dienen: Der Darstellung von Endprodukten mit gleicher Grundstruktur durch Verknüpfung dieser Verbindungen mit dem Pyrazolderivat über die Carbonylfunktion. Die vorliegende Auswahl dient daher keinem besonderen Zweck und bedingt keine Neuheit für die genannten Ansprüche.

Der wesentlichste Unterschied zwischen dem Gegenstand des vorliegenden **Anspruchs 9** gegenüber D1 und D2 ist die Natur des Substituenten L<sup>2</sup>. Anspruch 9 ist daher neu.

3 Erfinderische Tätigkeit (Artikel 33(3) PCT)

Das von der vorliegenden Anmeldung zu lösende **technische Problem** ist die Bereitstellung alternativer Herbizide im Vergleich zu den in den relevanten Dokumenten D1 und D2 offenbarten Verbindungen.

Die **technische Lösung** des Problems ist die Modifizierung der in D2 spezifisch offenbarten Strukturen durch Ersatz der Alkylsubstituenten am N-1-Atom des Pyrazolrings durch solche, die am  $\alpha$ -C-Atom (direkt an N-1 gebunden) verzweigt sind (z. B. sec-C<sub>4</sub>H<sub>9</sub>), wie durch die Definition der Reste R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> im vorliegenden Anspruch 1 festgelegt wurde.

**Die genannte Abänderung ist nun als erfinderischer Schritt zu bezeichnen, da der Anmelder durch Einreichen von Vergleichsdaten mit dem Brief vom 28.02.2001 einen vorteilhaften Effekt glaubhaft machen konnte:** So zeigen die Verbindungen 2.2 bzw. 2.23 der vorliegenden Anmeldung im Vergleich mit den Verbindungen 2.69 und A aus D2 (mit einem linearen Alkylsubstituenten am N-1-Atom) eine verbesserte herbizide Wirkung.

Es wird angefügt, daß in D2 Verbindungen erwähnt sind, die sogar eine Verzweigung in  $\beta$ -Stellung zu N-1 besitzen (Substituenten R<sup>6</sup> bzw. R<sup>16</sup>). Diese sind jedoch nicht als die strukturell naheliegendsten Verbindungen aus dem Stand der Technik zu bezeichnen, da diese konkret in D2 offenbarten Beispiele als Substituent R<sup>1</sup> Chlor und nicht Methyl- oder eine andere Alkylgruppe enthalten (vgl. Definition von R<sup>1</sup> im vorliegenden Anspruch 1).

**Der in der vorliegenden Anmeldung dargelegte Anspruch 1 und die Ansprüche 2 bis 7 und 10 bis 13, welche sich auf Anspruch 1 beziehen, erfüllen demnach die Erfordernisse des Artikels 33(3) PCT, weil sie auf einer erfinderischen Tätigkeit beruhen.**

**Die Intermediate der Formeln (III) und (V) aus den Ansprüchen 8 und 9 sind per se nicht erfinderisch, da sie nicht das charakteristische Merkmal, d.h. die  $\alpha$ -verzweigte alkyliche Gruppierung am N-1, zur Struktur der erfinderischen Endprodukte beitragen.**

**4 Gewerbliche Anwendbarkeit (Artikel 33(4) PCT)**

**Die in der vorliegenden Anmeldung dargelegten Patentansprüche 1 bis 13  
sind gewerblich anwendbar gemäß Artikel 33(4) PCT.**

**Zu Punkt VI**

**Bestimmte angeführte Unterlagen**

Das Dokument D3 ist kein Stand der Technik im Sinne von Regel 64.1(b) PCT:

D3: WO 99 23094 A

**Zu Punkt VIII**

**Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung**

**Anspruch 11** ("Verfahren zur Herstellung von Mitteln...") soll sich vermutlich auf  
Anspruch 10 ("Mittel, ...") und nicht auf Anspruch 8 beziehen.

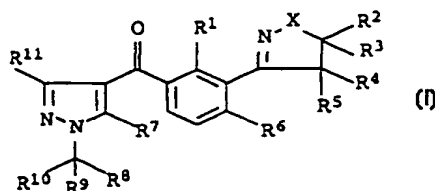


**PCT**WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales BüroINTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation <sup>7</sup> : C07D 413/00		A2	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 00/34273
			(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 15. Juni 2000 (15.06.00)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP99/09413			Gunterstrasse 28, D-67069 Ludwigshafen (DE). WEST-PHALEN, Karl-Otto [DE/DE]; Zum Pfauenturm 17, D-67346 Speyer (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]; Grünstadter Strasse 82, D-67283 Obrigheim (DE).
(22) Internationales Anmeldedatum: 2. Dezember 1999 (02.12.99)			
(30) Prioritätsdaten: 198 55 850.3 4. Dezember 1998 (04.12.98) DE 199 36 514.8 6. August 1999 (06.08.99) DE			
(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE).			
(72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): NEIDLEIN, Ulf [DE/DE]; Brahmssstrasse 3, D-68165 Mannheim (DE). GÖTZ, Norbert [DE/DE]; Schöfferstrasse 25, D-67547 Worms (DE). BAUMANN, Ernst [DE/DE]; Falkenstrasse 6a, D-67373 Dudenhofen (DE). VON DEYN, Wolfgang [DE/DE]; An der Bleiche 24, D-67435 Neustadt (DE). KUDIS, Steffen [DE/DE]; Spelzenstrasse 10, D-68167 Mannheim (DE). LANGEMANN, Klaus [DE/DE]; Goldbergstrasse 18, D-67551 Worms (DE). MAYER, Guido [DE/DE]; Gutleuthausstrasse 8, D-67433 Neustadt (DE). MISSLITZ, Ulf [DE/DE]; Mandelring 74, D-67433 Neustadt (DE). WITSCHEL, Matthias [DE/DE]; Wittelsbachstrasse 81, D-67061 Ludwigshafen (DE). OTTEN, Martina [DE/DE];			
			(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE).
			(81) Bestimmungsstaaten: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
			Veröffentlicht Ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts.

(54) Title: 3-(HETEROCYCLYL)-SUBSTITUTED BENZOYLPIRAZOLS

(54) Bezeichnung: 3-(HETEROCYCLYL)-SUBSTITUIERTE BENZOYLPIRAZOLE



## (57) Abstract

The invention relates to 3-(heterocyclyl)-substituted benzoylpyrazols of formula (I), wherein the variables have the following meanings: X is O, NH or N-alkyl; R<sup>1</sup> is alkyl; R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> are hydrogen, alkyl or alkyl halide; R<sup>6</sup> is halogen, nitro, alkyl halide, alkoxy, halogenalkoxy, alkylthio, halogenalkylthio, alkylsulfonyl or halogenalkylsulfonyl; R<sup>7</sup> is hydroxy, alkoxy, alkenyloxy, alkylsulfonyloxy, alkylcarbonyloxy, alkylthiocarbonyloxy, phenylsulfonyloxy or phenylcarbonyloxy, and the phenyl radical can be substituted; R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> are alkyl; R<sup>10</sup> is hydrogen or alkyl; and R<sup>11</sup> is hydrogen or alkyl; and to their agriculturally useable salts. The invention also relates to intermediate products and methods for producing the inventive compounds and to the use of these compounds or products containing them for combating undesirable plants.

## (57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft 3-(Heterocyclyl)-substituierte Benzoylpyrazole der Formel (I), in der die Variablen folgende Bedeutung haben: X O, NH oder N-Alkyl; R<sup>1</sup> Alkyl; R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl; R<sup>6</sup> Halogen, Nitro, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkylsulfonyl oder Halogenalkylsulfonyl; R<sup>7</sup> Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkylsulfonyloxy, Alkylcarbonyloxy, Alkylthiocarbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest substituiert sein kann; R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> Alkyl; R<sup>10</sup> Wasserstoff oder Alkyl; R<sup>11</sup> Wasserstoff oder Alkyl; sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze. Zwischenprodukte und Verfahren zu ihrer Herstellung; sowie die Verwendung dieser Verbindungen oder diese enthaltende Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen.

He

# *LEDIGLICH ZUR INFORMATION*

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

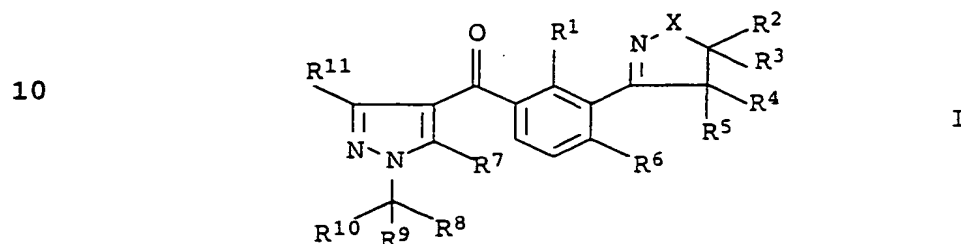
AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
EE	Estland						

## 3- (Heterocyclyl) -substituierte Benzoylpyrazole

## Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft 3- (Heterocyclyl) -substituierte Benzoylpyrazole der Formel I



15

in der die Variablen folgende Bedeutung haben:

X O, NH oder N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl);

20 R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl;

25 R<sup>6</sup> Halogen, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl;

30 R<sup>7</sup> Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>- (Alkylthio)carbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest der beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:

35 Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;

40 R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

R<sup>10</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
wobei die Anzahl der Kohlenstoffatome der Reste R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> zusammen maximal 7 beträgt,

45 R<sup>11</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

Außerdem betrifft die Erfindung Zwischenprodukte und Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, Mittel welche  
5 diese enthalten sowie die Verwendung dieser Derivate oder diese enthaltende Mittel zur Schadpflanzenbekämpfung.

Aus der Literatur, beispielsweise aus WO 96/26206 und WO 98/31681 sind Pyrazol-4-yl-benzoylderivate bekannt.

10

Die herbiziden Eigenschaften der bisher bekannten Verbindungen sowie die Verträglichkeiten gegenüber Kulturpflanzen können jedoch nur bedingt befriedigen. Es lag daher dieser Erfindung die Aufgabe zugrunde, neue, insbesondere herbizid wirksame, Ver-  
15 bindungen mit verbesserten Eigenschaften zu finden.

Demgemäß wurden die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I sowie deren herbizide Wirkung gefunden.

20 Ferner wurden herbizide Mittel gefunden, die die Verbindungen I enthalten und eine sehr gute herbizide Wirkung besitzen. Außerdem wurden Verfahren zur Herstellung dieser Mittel und Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs mit den Verbindungen I gefunden.

25

Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren enthalten und liegen dann als Enantiomeren oder Diastereomeregemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomeren oder Diastereomeren  
30 als auch deren Gemische.

Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es auf die Art des Salzes in der Regel nicht ankommt. Im allgemeinen kommen die  
35 Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen, beziehungsweise Anionen, die herbizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen.

40 Es kommen als Kationen, insbesondere Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch  
45 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Phenyl oder Benzyl ersetzt sein können, vorzugsweise Ammonium, Dimethylammonium, Diisopropylammo-

nium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, 2-(2-Hydroxyeth-1-oxy)eth-1-ylammonium, Di(2-hydroxyeth-1-yl)ammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, 5 vorzugsweise Tri(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

Anionen von brauchbaren Säureadditionsalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, 10 Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.

Die für die Substituenten R<sup>1</sup>-R<sup>11</sup> oder als Reste an Phenylringen 15 genannten organischen Molekülteile stellen Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenwasserstoffketten, also alle Alkyl-, Alkylcarbonyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkylcarbonyloxy-, (Alkylthio)carbonyloxy-, Alkylsulfonyloxy-, Alkylthio-, Halogenalkylthio-, Alkylsulfonyl-, Halogenalkylsulfonyl-, Alkenyl- und Alkenyloxy-Teile können geradkettig oder verzweigt sein. Sofern nicht anders angegeben tragen halogenierte Substituenten vorzugsweise ein bis fünf gleiche oder verschiedene Halogenatome. Die Bedeutung Halogen steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder Iod.

25

Ferner bedeuten beispielsweise:

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, sowie die Alkylteile von C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy: z.B. Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl; 30
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, sowie die Alkylteile von C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, wie voranstehend genannt, 35 sowie z.B. Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 40 1,1,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-3-methylpropyl;
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylrest wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Chlormethyl, 45 Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl,

- 5 Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlor-  
difluormethyl, Brommethyl, Iodmethyl, 1-Fluorethyl, 1-Chlore-  
thyl, 1-Bromethyl, 1-Iodethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl,  
2-Bromethyl, 2-Iodethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluor-  
ethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl,  
2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl, Pentafluor-  
ethyl, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl, 2,2-Difluorpropyl,  
2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl, 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlor-  
propyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl, 3,3,3-Trifluorpropyl,  
10 3,3,3-Trichlorpropyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluor-  
propyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlorme-  
thyl)-2-chlorethyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl,  
4-Chlorbutyl, 4-Brombutyl und Nonafluorbutyl;
- 15 - C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy: z.B. Methoxy, Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy,  
Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethyl-  
ethoxy;
- 20 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy wie voranstehend genannt, sowie  
z.B. Pentoxy, 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methylbutoxy,  
1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-Dimethylpropoxy, 2,2-Dimethylprop-  
oxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy, 2-Methylpent-  
oxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy, 1,1-Dimethylbut-  
oxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy, 2,2-Dimethylbut-  
25 oxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy, 1-Ethylbutoxy,  
2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy, 1,2,2-Trimethylprop-  
oxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy und 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
- 30 - C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxyrest wie voranstehend  
genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,  
Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxy,  
Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Bromdi-  
fluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Brommethoxy,  
2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy,  
35 2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Di-  
chlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluorethoxy,  
2-Fluorpropoxy, 3-Fluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorprop-  
oxy, 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 2,2-Difluorpropoxy,  
2,3-Difluorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy, 3,3,3-Trifluorprop-  
40 oxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy,  
Heptafluorpropoxy, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxy, 1-(Chlorme-  
thyl)-2-chlorethoxy, 1-(Brommethyl)-2-bromethoxy, 4-Fluorbut-  
oxy, 4-Chlorbutoxy, 4-Brombutoxy und Nonafluorbutoxy;
- 45

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, sowie die Alkylthioteile von C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-(Alkylthio)carbonyloxy: z.B. Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio, Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio und 1,1-Dimethylethylthio;
- 5
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthiorest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Bromdifluormethylthio, 2-Fluorethylthio, 2-Chlorethylthio, 2-Bromethylthio, 2-Iodethylthio, 2,2-Difluorethylthio, 2,2,2-Trifluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio, 2-Chlor-2-fluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio, 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio, Pentafluorethylthio, 2-Fluorpropylthio, 3-Fluorpropylthio, 2-Chlorpropylthio, 3-Chlorpropylthio, 2-Brompropylthio, 3-Brompropylthio, 2,2-Difluorpropylthio, 2,3-Difluorpropylthio, 2,3-Dichlorpropylthio, 3,3,3-Trifluorpropylthio, 3,3,3-Trichlorpropylthio, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylthio, Heptafluorpropylthio, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylthio, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylthio, 1-(Brommethyl)-2-bromethylthio, 4-Fluorbutylthio, 4-Chlorbutylthio, 4-Brombutylthio und Nonafluorbutylthio;
- 10
- 15
- 20
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-S(=O)<sub>2</sub>-), sowie die Alkylsulfonylteile von C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyloxy: z.B. Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl, Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methylpropylsulfonyl und 1,1-Dimethylethylsulfonyl;
- 25
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, sowie die Alkylsulfonylteile von C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyloxy: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonylrest wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentylsulfonyl, 1-Methylbutylsulfonyl, 2-Methylbutylsulfonyl, 3-Methylbutylsulfonyl, 1,1-Dimethylpropylsulfonyl, 1,2-Dimethylpropylsulfonyl, 2,2-Dimethylpropylsulfonyl, 1-Ethylpropylsulfonyl, Hexylsulfonyl, 1-Methylpentylsulfonyl, 2-Methylpentylsulfonyl, 3-Methylpentylsulfonyl, 4-Methylpentylsulfonyl, 1,1-Dimethylbutylsulfonyl, 1,2-Dimethylbutylsulfonyl, 1,3-Dimethylbutylsulfonyl, 2,2-Dimethylbutylsulfonyl, 2,3-Dimethylbutylsulfonyl, 3,3-Dimethylbutylsulfonyl, 1-Ethylbutylsulfonyl, 2-Ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1,2,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfonyl und 1-Ethyl-2-methylpropylsulfonyl;
- 30
- 35
- 40
- 45
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonylrest wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B.

Fluormethylsulfonyl, Difluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl, Bromdifluormethylsulfonyl, 2-Fluorethylsulfonyl, 2-Chlorethylsulfonyl, 2-Bromethylsulfonyl, 2-Iodethylsulfonyl, 2,2-Difluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfonyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl, Pentafluorethylsulfonyl, 2-Fluorpropylsulfonyl, 3-Fluorpropylsulfonyl, 2-Chlorpropylsulfonyl, 3-Chlorpropylsulfonyl, 2-Brompropylsulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl, 2,2-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Dichlorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trichlorpropylsulfonyl, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfonyl, Heptafluorpropylsulfonyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfonyl, 4-Fluorbutylsulfonyl, 4-Chlorbutylsulfonyl, 4-Brombutylsulfonyl und Nonafluorbutylsulfonyl;

- C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy: z.B. Prop-1-en-1-yloxy, Prop-2-en-1-yloxy, 1-Methylethenyloxy, Buten-1-yloxy, Buten-2-yloxy, Buten-3-yloxy, 1-Methyl-prop-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-prop-1-en-1-yloxy, 1-Methyl-prop-2-en-1-yloxy, 2-Methyl-prop-2-en-1-yloxy, Penten-1-yloxy, Penten-2-yloxy, Penten-3-yloxy, Penten-4-yloxy, 1-Methyl-but-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-but-1-en-1-yloxy, 3-Methyl-but-1-en-1-yloxy, 1-Methyl-but-2-en-1-yloxy, 2-Methyl-but-2-en-1-yloxy, 3-Methyl-but-2-en-1-yloxy, 1-Methyl-but-3-en-1-yloxy, 2-Methyl-but-3-en-1-yloxy, 3-Methyl-but-3-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-prop-1-en-2-yloxy, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yloxy, Hex-1-en-1-yloxy, Hex-2-en-1-yloxy, Hex-3-en-1-yloxy, Hex-4-en-1-yloxy, Hex-5-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 2-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 4-Methyl-pent-1-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 2-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 4-Methyl-pent-2-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 2-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 4-Methyl-pent-3-en-1-yloxy, 1-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 2-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 3-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 4-Methyl-pent-4-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy, 2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yloxy, 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-yloxy, 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yloxy,



- 1-Ethyl-but-1-en-1-yloxy, 1-Ethyl-but-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-but-3-en-1-yloxy, 2-Ethyl-but-1-en-1-yloxy, 2-Ethyl-but-2-en-1-yloxy, 2-Ethyl-but-3-en-1-yloxy, 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yloxy, 1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yloxy und 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yloxy;
- C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl: Prop-1-en-1-yl, Prop-2-en-1-yl, 1-Methylethenyl, Buten-1-yl, Buten-2-yl, Buten-3-yl, 1-Methyl-prop-1-en-1-yl, 2-Methyl-prop-1-en-1-yl, 1-Methyl-prop-2-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, Penten-1-yl, Penten-2-yl, Penten-3-yl, Penten-4-yl, 1-Methyl-but-1-en-1-yl, 2-Methyl-but-1-en-1-yl, 3-Methyl-but-1-en-1-yl, 1-Methyl-but-2-en-1-yl, 2-Methyl-but-2-en-1-yl, 3-Methyl-but-2-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl, 2-Methyl-but-3-en-1-yl, 3-Methyl-but-3-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-prop-1-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-prop-1-en-2-yl, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yl, Hex-1-en-1-yl, Hex-2-en-1-yl, Hex-3-en-1-yl, Hex-4-en-1-yl, Hex-5-en-1-yl, 1-Methyl-pent-1-en-1-yl, 2-Methyl-pent-1-en-1-yl, 3-Methyl-pent-1-en-1-yl, 4-Methyl-pent-1-en-1-yl, 1-Methyl-pent-2-en-1-yl, 2-Methyl-pent-2-en-1-yl, 3-Methyl-pent-2-en-1-yl, 4-Methyl-pent-2-en-1-yl, 1-Methyl-pent-3-en-1-yl, 2-Methyl-pent-3-en-1-yl, 3-Methyl-pent-3-en-1-yl, 4-Methyl-pent-3-en-1-yl, 1-Methyl-pent-4-en-1-yl, 2-Methyl-pent-4-en-1-yl, 3-Methyl-pent-4-en-1-yl, 4-Methyl-pent-4-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-but-1-en-1-yl, 1-Ethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-but-3-en-1-yl, 2-Ethyl-but-1-en-1-yl, 2-Ethyl-but-2-en-1-yl, 2-Ethyl-but-3-en-1-yl, 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-2-methyl-prop-1-en-1-yl und 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yl;

Die Phenylringe sind vorzugsweise unsubstituiert oder tragen ein bis drei Halogenatome und/oder eine Nitrogruppe, eine Cyano-  
 45 gruppe, eine oder zwei Methyl-, Trifluormethyl-, Methoxy- oder Trifluormethoxygruppen.

Betont seien diejenigen 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, wobei

- 5 R<sup>7</sup> Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest der beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;
- 10

bedeutet.

- Bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, in der die Variablen folgende Bedeutung haben:
- 15

X O;

- 20 R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl;  
insbesondere bevorzugt Methyl;

- 25 R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl;  
besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Fluormethyl oder Chlormethyl;  
insbesondere bevorzugt Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Chlormethyl;

- 30 R<sup>6</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl;  
besonders bevorzugt Methylthio, Ethylthio oder 1-Methyl-1-ethylthio, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl oder Propylsulfonyl;  
insbesondere bevorzugt Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl oder Propylsulfonyl;
- 35

- 40 R<sup>7</sup> Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-(Alkylthio)carbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest der beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:
- 45 Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;

besonders bevorzugt Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest der beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:  
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;

R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methyl-1-ethyl, Butyl, 1-Methyl-1-propyl und 2-Methyl-1-propyl;

R<sup>10</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
insbesondere bevorzugt Methyl, Ethyl oder Propyl;

R<sup>11</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt Wasserstoff oder Methyl;

Insbesondere bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, wobei

X O;

R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl;  
insbesondere bevorzugt Methyl;

R<sup>6</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl;  
besonders bevorzugt Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, 1-Methyl-1-ethylsulfonyl oder Propylsulfonyl;

R<sup>7</sup> Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest der beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:  
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;  
besonders bevorzugt Hydroxy;

R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

R<sup>10</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

bedeuten.

5 Außerordentlich bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, wobei

R<sup>8</sup> C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, z.B. Ethyl, 1-Methyl-1-ethyl, Propyl oder Butyl;

10

R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, z.B. Methyl oder Ethyl;

R<sup>10</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, z.B. Methyl oder Ethyl;

15

bedeuten.

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, wobei

20

R<sup>8</sup> Methyl;

R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, z.B. Methyl, Ethyl, Propyl oder Butyl;

25

R<sup>10</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, z.B. Methyl oder Ethyl;

bedeuten.

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, wobei

30

R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> Methyl;

R<sup>10</sup> Wasserstoff;

35

bedeuten.

- Ebenso bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, in der die Variablen folgende Bedeutung haben:

40

X O;

R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl;  
insbesondere bevorzugt Methyl;

45

- R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl;  
besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl, Ethyl,  
Propyl, 1-Methyl-1-ethyl, Chlormethyl oder Fluor-  
methyl;  
5 insbesondere bevorzugt Wasserstoff, Methyl, Ethyl  
oder Chlormethyl;
- R<sup>6</sup> Halogen, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy  
oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;  
10 besonders bevorzugt Halogen, wie Chlor oder Brom,  
Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl, wie Difluormethyl oder  
Trifluormethyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalk-  
oxy, wie Difluormethoxy, Chlordifluormethoxy oder  
Trifluormethoxy;
- 15 R<sup>7</sup> Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Al-  
kylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-(Al-  
kylthio)carbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phe-  
nylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest der beiden  
20 letztgenannten Substituenten partiell oder voll-  
ständig halogeniert sein kann und/oder eine bis  
drei der folgenden Gruppen tragen kann:  
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;  
25 besonders bevorzugt Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Al-  
kylcarbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcar-  
bonyloxy, wobei der Phenylrest der beiden letztge-  
30 nannten Substituenten partiell oder vollständig  
halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der  
folgenden Gruppen tragen kann:  
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;
- 35 R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Me-  
thyl-1-ethyl, Butyl, 1-Methyl-1-propyl und 2-Me-  
thyl-1-propyl;
- 40 R<sup>10</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
insbesondere bevorzugt Methyl, Ethyl oder Propyl;
- R<sup>11</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
45 besonders bevorzugt Wasserstoff oder Methyl;

Insbesondere bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, wobei

- 5 X O;
- R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl;  
insbesondere bevorzugt Methyl;
- 10 R<sup>6</sup> Halogen, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy  
oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;  
besonders bevorzugt Halogen, wie Chlor oder Brom,  
Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkyl, wie Difluormethyl oder  
15 Trifluormethyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-Halogenalkoxy,  
wie Difluormethoxy;
- R<sup>7</sup> Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbo-  
nyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbo-  
20 nyloxy, wobei der Phenylrest der beiden letztgenannten  
Substituenten partiell oder vollständig halogeniert  
sein kann und/oder eine bis drei der folgenden  
Gruppen tragen kann:  
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,  
25 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;  
besonders bevorzugt Hydroxy;
- R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;
- 30 R<sup>10</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;
- bedeuten.
- Außerordentlich bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, wobei
- 35 R<sup>8</sup> C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, z.B. Ethyl, 1-Methyl-1-ethyl, Propyl  
oder Butyl;
- R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, z.B. Methyl oder Ethyl;
- 40 R<sup>10</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, z.B. Methyl oder  
Ethyl;
- bedeuten.
- 45

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierte Benzoylpyrazole der Formel I, wobei

R<sup>8</sup> Methyl;

R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, z.B. Methyl, Ethyl, Propyl oder Butyl;

R<sup>10</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, z.B. Methyl oder Ethyl;

bedeuten.

Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, wobei

R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> Methyl;

R<sup>10</sup> Wasserstoff;

bedeuten.

- Ebenso bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, in der die Variablen folgende Bedeutung haben:

X N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl);  
besonders bevorzugt N-Methyl, N-Ethyl, N-(1-Methyl-1-ethyl) oder N-Propyl;

R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl;  
insbesondere bevorzugt Methyl;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl;  
besonders bevorzugt Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methyl-1-ethyl, Fluormethyl oder Chlormethyl;  
insbesondere bevorzugt Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Chlormethyl;

R<sup>6</sup> Halogen, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl;  
besonders bevorzugt Halogen, wie Fluor, Chlor oder Brom, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, wie Difluormethyl oder Trifluormethyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, wie Methoxy oder Ethoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy wie Difluormethoxy,

5 Chlordifluormethoxy oder Trifluormethoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio wie Methylthio oder Ethylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl, wie Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, 1-Methyl-1-ethylsulfonyl oder Propylsulfonyl;

10 R<sup>7</sup> Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-(Alkylthio)carbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest der beiden  
15 letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:  
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;  
20 besonders bevorzugt Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest der beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig  
25 halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:  
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;

30 R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methyl-1-ethyl, Butyl, 1-Methyl-1-propyl und 2-Methyl-1-propyl;

35 R<sup>10</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
insbesondere bevorzugt Methyl, Ethyl oder Propyl;

40 R<sup>11</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt Wasserstoff oder Methyl;

Insbesondere bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, wobei

45 R<sup>7</sup> Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest der beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:  
Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,



C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;  
besonders bevorzugt Hydroxy;

- Ebenso bevorzugt sind die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, in der die Variablen folgende Bedeutung haben:

X O;

R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl;  
besonders bevorzugt Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl;

R<sup>6</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl;  
besonders bevorzugt Methylsulfonyl;

R<sup>7</sup> Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-(Alkylthio)carbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest der beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy; besonders bevorzugt Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl-Reste tragen kann;

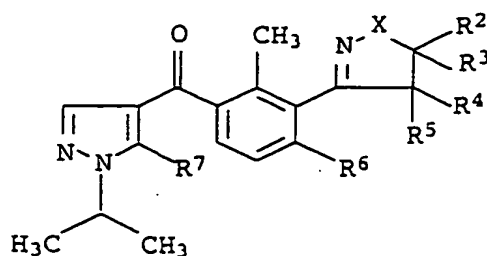
R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

R<sup>10</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

R<sup>11</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl.

Außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia1 ( $\equiv$ I mit R<sup>1</sup>, R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> = CH<sub>3</sub>; R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> = H), insbesondere die Verbindungen Ia1.1 bis Ia1.300 der Tabelle 1, wobei die Redefinitionen X und R<sup>1</sup> bis R<sup>11</sup> nicht nur in Kombination miteinander, sondern auch jeweils für sich allein betrachtet für die erfindungsgemäßen Verbindungen eine besondere Bedeutung haben.

16



Ia1

Tabelle 1:

Nr.	X	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
Ia1.1	O	H	H	H	H	SCH <sub>3</sub>	OH
Ia1.2	O	H	H	H	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
Ia1.3	O	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
Ia1.4	O	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
Ia1.5	O	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
Ia1.6	O	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
Ia1.7	O	H	H	H	H	Cl	OH
Ia1.8	O	H	H	H	H	Br	OH
Ia1.9	O	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	OH
Ia1.10	O	H	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	OH
Ia1.11	O	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	OH
Ia1.12	O	H	H	H	H	OCH <sub>3</sub>	OH
Ia1.13	O	H	H	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
Ia1.14	O	H	H	H	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
Ia1.15	O	H	H	H	H	OCF <sub>3</sub>	OH
Ia1.16	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SCH <sub>3</sub>	OH
Ia1.17	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
Ia1.18	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
Ia1.19	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
Ia1.20	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
Ia1.21	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
Ia1.22	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	Cl	OH
Ia1.23	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	Br	OH
Ia1.24	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	NO <sub>2</sub>	OH
Ia1.25	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	OH
Ia1.26	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CF <sub>3</sub>	OH
Ia1.27	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	OCH <sub>3</sub>	OH
Ia1.28	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
Ia1.29	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
Ia1.30	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H	OCF <sub>3</sub>	OH
Ia1.31	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>3</sub>	OH

	Nr.	X	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
5	Ia1.32	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.33	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.34	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.35	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.36	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
10	Ia1.37	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	Cl	OH
	Ia1.38	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	Br	OH
	Ia1.39	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.40	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.41	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	OH
15	Ia1.42	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.43	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.44	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.45	O	H	H	CH <sub>3</sub>	H	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.46	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	SCH <sub>3</sub>	OH
20	Ia1.47	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.48	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.49	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.50	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.51	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
25	Ia1.52	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	OH
	Ia1.53	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	Br	OH
	Ia1.54	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.55	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.56	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	OH
30	Ia1.57	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.58	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.59	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.60	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.61	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>3</sub>	OH
35	Ia1.62	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.63	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.64	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.65	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.66	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
40	Ia1.67	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	Cl	OH
	Ia1.68	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	Br	OH
	Ia1.69	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.70	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	OH

	Nr.	X	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
	Ia1.71	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.72	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	OH
5	Ia1.73	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.74	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.75	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.76	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH
10	Ia1.77	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.78	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.79	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.80	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.81	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
15	Ia1.82	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	OH
	Ia1.83	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	OH
	Ia1.84	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.85	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	OH
20	Ia1.86	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.87	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.88	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.89	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OH
25	Ia1.90	O	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.91	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.92	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.93	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
30	Ia1.94	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.95	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.96	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.97	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Cl	OH
	Ia1.98	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Br	OH
35	Ia1.99	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.100	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.101	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.102	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	OH
40	Ia1.103	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.104	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.105	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.106	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH
45	Ia1.107	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.108	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.109	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH

	Nr.	X	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
	Ia1.110	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.111	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
5	Ia1.112	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	OH
	Ia1.113	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	OH
	Ia1.114	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.115	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	OH
10	Ia1.116	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.117	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.118	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.119	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.120	O	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	OH
15	Ia1.121	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.122	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.123	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.124	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
20	Ia1.125	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.126	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.127	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	OH
	Ia1.128	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	OH
25	Ia1.129	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.130	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.131	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.132	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.133	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
30	Ia1.134	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.135	O	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.136	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.137	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
35	Ia1.138	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.139	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.140	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.141	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
40	Ia1.142	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	Cl	OH
	Ia1.143	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	Br	OH
	Ia1.144	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.145	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	OH
45	Ia1.146	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.147	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.148	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH

	Nr.	X	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
5	Ia1.149	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.150	O	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.151	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.152	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.153	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
10	Ia1.154	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.155	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.156	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.157	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	Cl	OH
	Ia1.158	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	Br	OH
15	Ia1.159	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.160	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.161	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.162	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.163	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
20	Ia1.164	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.165	NCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.166	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.167	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.168	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
25	Ia1.169	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.170	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.171	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.172	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	Cl	OH
	Ia1.173	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	Br	OH
30	Ia1.174	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.175	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.176	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.177	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.178	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
35	Ia1.179	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.180	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.181	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.182	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.183	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
40	Ia1.184	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.185	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.186	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.187	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	Cl	OH
	Ia1.187	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	Cl	OH

	Nr.	X	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
	Ia1.188	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	Br	OH
	Ia1.189	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	OH
5	Ia1.190	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.191	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.192	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.193	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
10	Ia1.194	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.195	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.196	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	SCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.197	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.198	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
15	Ia1.199	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.200	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.201	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.202	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	OH
20	Ia1.203	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	Br	OH
	Ia1.204	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.205	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.206	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	OH
25	Ia1.207	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.208	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.209	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.210	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	OCF <sub>3</sub>	OH
30	Ia1.211	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.212	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.213	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.214	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.215	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
35	Ia1.216	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.217	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	Cl	OH
	Ia1.218	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	Br	OH
	Ia1.219	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	OH
40	Ia1.220	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.221	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.222	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.223	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
45	Ia1.224	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.225	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.226	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH

	Nr.	X	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
5	Ia1.227	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.228	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.229	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.230	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.231	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
10	Ia1.232	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	OH
	Ia1.233	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	OH
	Ia1.234	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.235	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.236	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OH
15	Ia1.237	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.238	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.239	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.240	NCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.241	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>3</sub>	OH
20	Ia1.242	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.243	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.244	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.245	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.246	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
25	Ia1.247	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Cl	OH
	Ia1.248	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Br	OH
	Ia1.249	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.250	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.251	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CF <sub>3</sub>	OH
30	Ia1.252	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.253	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.254	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.255	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.256	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH
35	Ia1.257	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.258	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.259	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.260	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.261	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
40	Ia1.262	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	OH
	Ia1.263	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	OH
	Ia1.264	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.265	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.265	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	OH

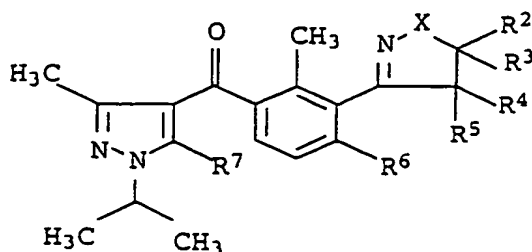


	Nr.	X	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>
	Ia1.266	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.267	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OH
5	Ia1.268	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.269	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.270	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.271	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	OH
10	Ia1.272	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.273	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.274	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.275	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.276	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
15	Ia1.277	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	OH
	Ia1.278	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	OH
	Ia1.279	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.280	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>	OH
20	Ia1.281	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.282	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.283	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.284	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCHF <sub>2</sub>	OH
25	Ia1.285	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	OCF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.286	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SCH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.287	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.288	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.289	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
30	Ia1.290	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OH
	Ia1.291	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.292	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	Cl	OH
	Ia1.293	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	Br	OH
35	Ia1.294	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	NO <sub>2</sub>	OH
	Ia1.295	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.296	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	CF <sub>3</sub>	OH
	Ia1.297	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	OCH <sub>3</sub>	OH
40	Ia1.298	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH
	Ia1.299	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	OCHF <sub>2</sub>	OH
	Ia1.300	NCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	OCF <sub>3</sub>	OH

45 Ebenso außerordentlichst bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia2, insbesondere die Verbindungen Ia2.1 bis Ia2.300, die sich von den entsprechenden Verbindungen Ia1.1 bis Ia1.300 dadurch unterscheiden, daß R<sup>11</sup> für Methyl steht.

24

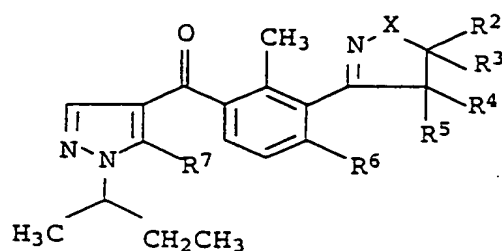
5



Ia2

Ebenso außerordentlichst bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia3, insbesondere die Verbindungen Ia3.1 bis Ia3.300, die sich von den Verbindungen Ia1.1 bis Ia1.300 dadurch unterscheiden, daß R<sup>8</sup> für Ethyl steht.

15

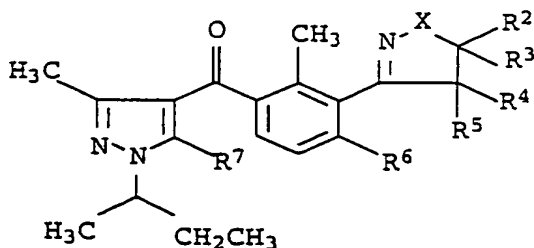


Ia3

20

Ebenso außerordentlichst bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia4, insbesondere die Verbindungen Ia4.1 bis Ia4.300, die sich von den Verbindungen Ia1.1 bis Ia1.300 dadurch unterscheiden, daß R<sup>8</sup> für Ethyl und R<sup>11</sup> für Methyl stehen.

25

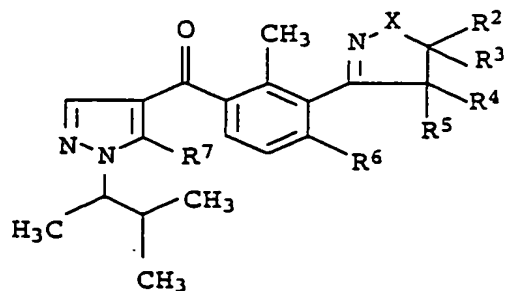


Ia4

30

Ebenso außerordentlichst bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia5, insbesondere die Verbindungen Ia5.1 bis Ia5.300, die sich von den Verbindungen Ia1.1 bis Ia1.300 dadurch unterscheiden, daß R<sup>8</sup> für 1-Methyl-1-ethyl steht.

40



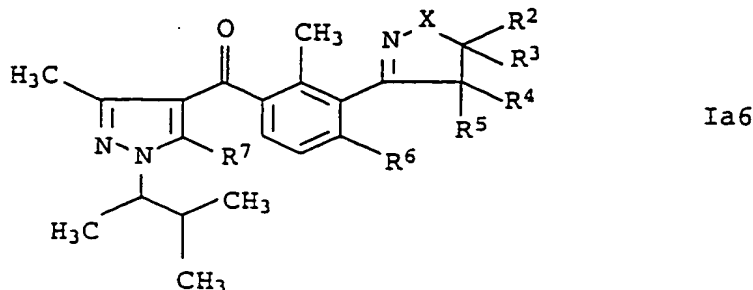
Ia5

45

Ebenso außerordentlichst bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia6, insbesondere die Verbindungen Ia6.1 bis Ia6.300, die sich von den Verbindungen Ia1.1 bis Ia1.300 dadurch unterscheiden, daß  $R^8$  für 1-Methyl-1-ethyl und  $R^{11}$  für Methyl stehen.

5

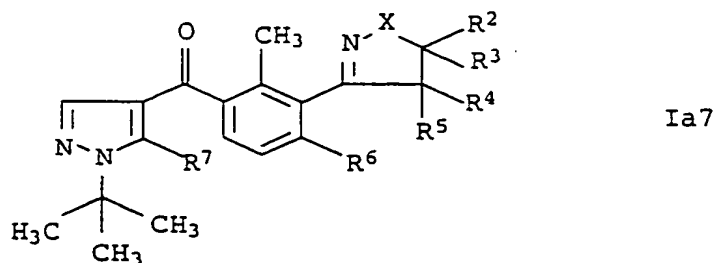
10



Ebenso außerordentlichst bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia7, insbesondere die Verbindungen Ia7.1 bis Ia7.300, die sich von den Verbindungen Ia1.1 bis Ia1.300 dadurch unterscheiden, daß  $R^{10}$  für Methyl steht.

20

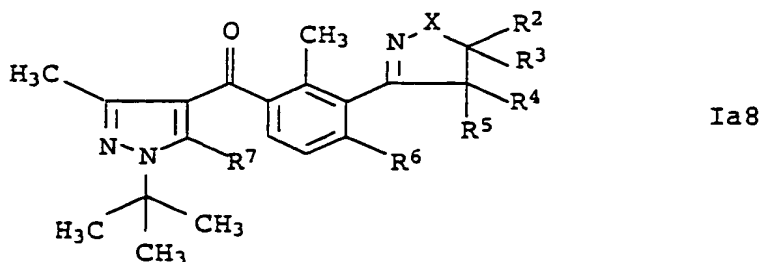
25



Ebenso außerordentlichst bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia8, insbesondere die Verbindungen Ia8.1 bis Ia8.300, die sich von den Verbindungen Ia1.1 bis Ia1.300 dadurch unterscheiden, daß  $R^{10}$  für Methyl und  $R^{11}$  für Methyl stehen.

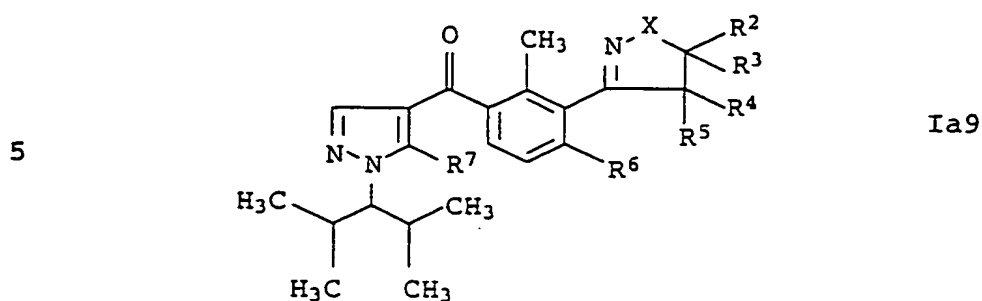
30

35

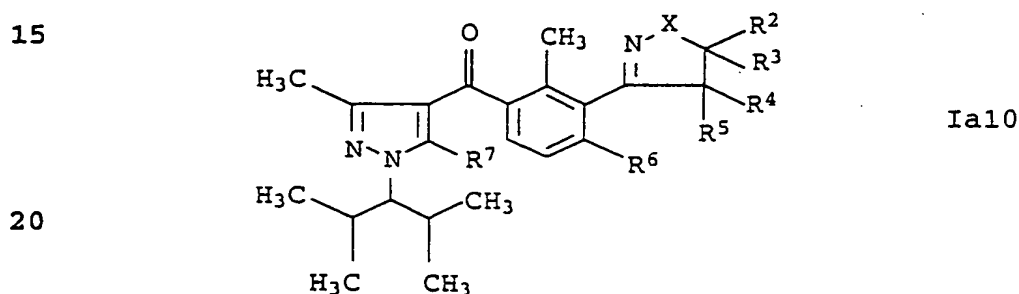


Ebenso außerordentlichst bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia9, insbesondere die Verbindungen Ia9.1 bis Ia9.300, die sich von den Verbindungen Ia1.1 bis Ia1.300 dadurch unterscheiden, daß  $R^8$  und  $R^9$  für 1-Methyl-1-ethyl stehen.

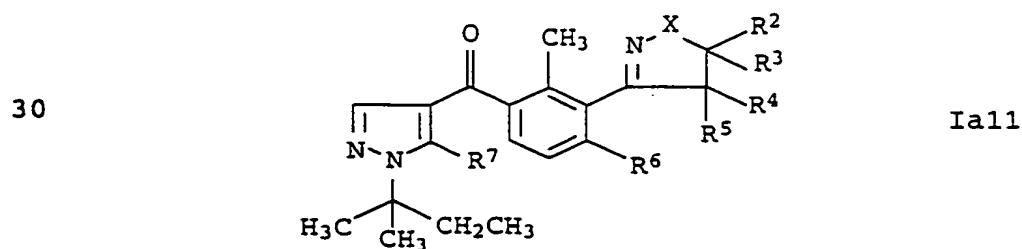
45



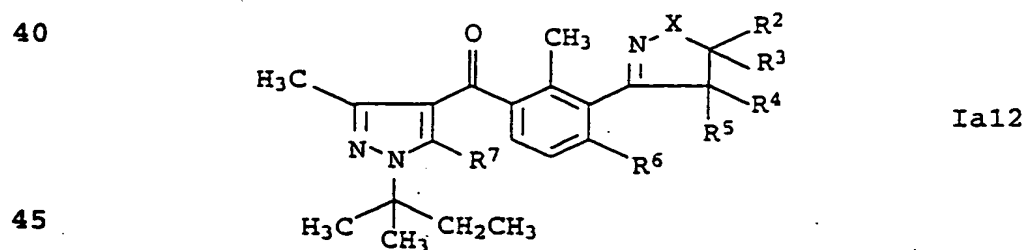
10 Ebenso außerordentlichst bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia10, insbesondere die Verbindungen Ia10.1 bis Ia10.300, die sich von den Verbindungen Ia1.1 bis Ia1.300 dadurch unterscheiden, daß  $R^8$  und  $R^9$  für 1-Methyl-1-ethyl und  $R^{11}$  für Methyl stehen.



Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia11, insbesondere die Verbindungen Ia11.1 bis Ia11.300, die sich von den Verbindungen Ia1.1 bis Ia1.300 dadurch unterscheiden, daß  $R^8$  für Ethyl und  $R^{10}$  für Methyl stehen.



35 Ebenso außerordentlich bevorzugt sind die Verbindungen der Formel Ia12, insbesondere die Verbindungen Ia12.1 bis Ia12.300, die sich von den Verbindungen Ia1.1 bis Ia1.300 dadurch unterscheiden, daß  $R^8$  für Ethyl und  $R^{10}$  und  $R^{11}$  für Methyl stehen.



Die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I, sind auf verschiedene Art und Weise erhältlich, beispielsweise nach folgenden Verfahren.

#### 5 Verfahren A:

Durch Umsetzung von Pyrazolen der Formel II mit einer aktivierten Benzoessäure III $\alpha$  oder einer Benzoessäure III $\beta$ , die vorzugsweise in situ aktiviert wird, zu dem entsprechenden Acylierungsprodukt IV  
10 und anschließende Umlagerung erhält man Verbindungen der Formel I mit  $R^7 = OH$ .

15

20

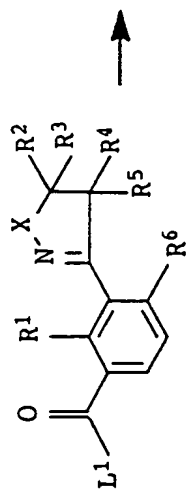
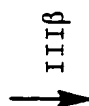
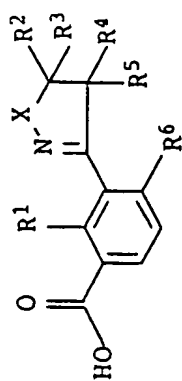
25

30

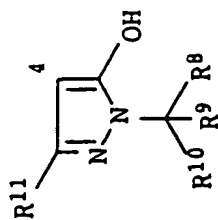
35

40

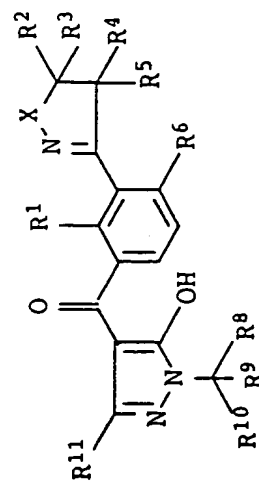
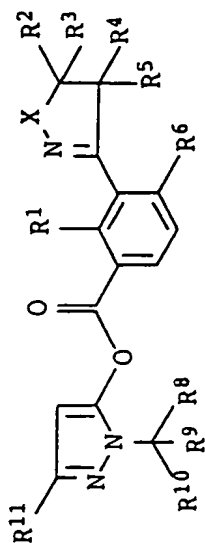
45



+



II

 $\text{III}\alpha$ I mit  $\text{R}^7 = \text{OH}$ 

IV

L<sup>1</sup> steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, wie Halogen z.B. Brom, Chlor, Hetaryl, z.B. Imidazolyl, Pyridyl, Carboxylat, z.B. Acetat, Trifluoracetat etc.

5

Die aktivierte Benzoessäure kann direkt eingesetzt werden, wie im Fall der Benzoylhalogenide oder in situ erzeugt werden, z.B. mit Dicyclohexylcarbodiimid, Triphenylphosphin/Azodicarbonsäureester, 2-Pyridindisulfid/Triphenylphosphin, Carbonyldiimidazol etc.

10

Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Acylierungsreaktion in Gegenwart einer Base auszuführen. Die Reaktanden und die Hilfsbase werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein geringer Überschuß der Hilfsbase z.B. 1,2 bis 15 1,5 Moläquivalente, bezogen auf II, kann unter Umständen vorteilhaft sein.

Als Hilfsbasen eignen sich tertiäre Alkylamine, Pyridin oder Alkalimetallcarbonate. Als Lösungsmittel können z.B. chlorierte

20 Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Ether, wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Dimethoxyethan, Tetrahydrofuran, Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid oder Ester wie 25 Essigsäureethylester oder Gemische hiervon verwendet werden.

Werden Benzoylhalogenide als aktivierte Carbonsäurekomponente eingesetzt, so kann es zweckmäßig sein, bei Zugabe dieses Reak-

30 tionspartners die Reaktionsmischung auf 0 - 10°C abzukühlen. Anschließend rührt man bei 20 - 100°C, vorzugsweise bei 25 - 50°C, bis die Umsetzung vollständig ist. Die Aufarbeitung erfolgt in üblicher Weise, z.B. wird das Reaktionsgemisch auf Wasser gegossen, das Wertprodukt extrahiert. Als Lösungsmittel eignen sich hierfür besonders Methylenchlorid, Diethylether, Dimethoxyethan 35 und Essigsäureethylester. Nach Trocknen der organischen Phase und Entfernen des Lösungsmittels kann der rohe Ester ohne weitere Reinigung zur Umlagerung eingesetzt werden.

Die Umlagerung der Ester zu den Verbindungen der Formel I erfolgt 40 zweckmäßigerweise bei Temperaturen von 20 bis 40°C in einem Lösungsmittel und in Gegenwart einer Base sowie gegebenenfalls mit Hilfe einer Cyanoverbindung als Katalysator.

Als Lösungsmittel können z.B. Acetonitril, Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Dioxan, Essigsäureethylester, Dimethoxyethan, Toluol oder Gemische hiervon verwendet werden. Bevorzugte Lösungsmittel sind Acetonitril und Dioxan.

5

Geeignete Basen sind tertiäre Amine wie Triethylamin, Pyridin oder Alkalicarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, die vorzugsweise in äquimolarer Menge oder bis zu einem vierfachen Überschuß, bezogen auf den Ester, eingesetzt werden. Bevorzugt werden Triethylamin oder Alkalicarbonate verwendet, vorzugsweise in doppelt äquimolaren Verhältnis in Bezug auf den Ester.

10

Als Cyanoverbindungen kommen anorganische Cyanide, wie Natriumcyanid, Kaliumcyanid und organische Cyanoverbindungen, wie Acetoncyanhydrin, Trimethylsilylcyanid in Betracht. Sie werden in einer Menge von 1 bis 50 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt. Vorzugsweise werden Acetoncyanhydrin oder Trimethylsilylcyanid, z.B. in einer Menge von 5 bis 15, vorzugsweise 10 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt.

20

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise erfolgen. Das Reaktionsgemisch wird z.B. mit verdünnter Mineralsäure, wie 5 %ige Salzsäure oder Schwefelsäure, angesäuert, mit einem organischen Lösungsmittel, z.B. Methylenchlorid, Essigsäureethylester extrahiert. Der organische Extrakt kann mit 5-10%iger Alkalicarbonatlösung, z.B. Natriumcarbonat-, Kaliumcarbonatlösung extrahiert werden. Die wäßrige Phase wird angesäuert und der sich bildende Niederschlag abgesaugt und/oder mit Methylenchlorid oder Essigsäureethylester extrahiert, getrocknet und eingeengt. (Beispiele für die Darstellung von Estern von Hydroxypyrazolen und für die Umlagerung der Ester sind z.B. in EP-A 282 944 und US 4 643 757 genannt).

25

30

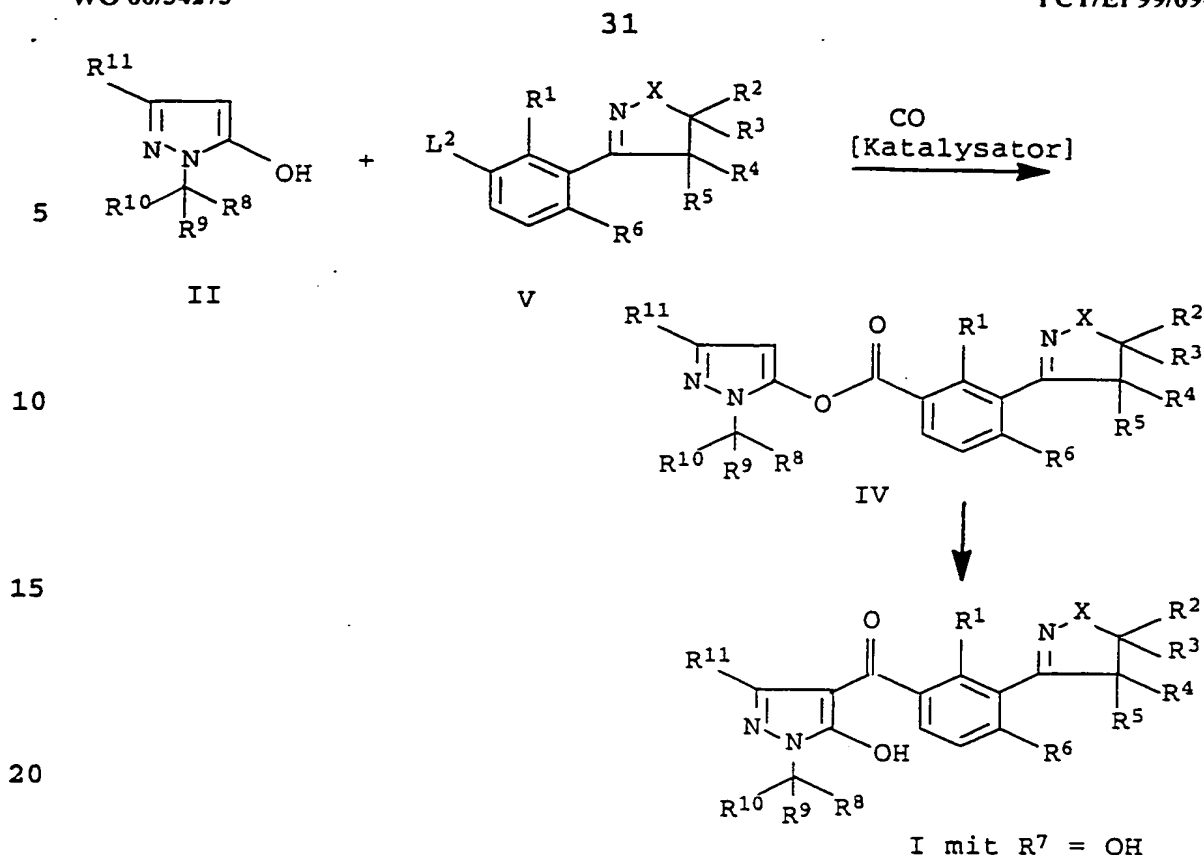
Es ist aber auch möglich, das "Acylierungsprodukt" IV in situ zu erzeugen, indem man ein Pyrazol der Formel II, oder ein Alkalisalz hiervon, mit einem 3-(Heterocyclyl)-benzol-Derivat der Formel V in Gegenwart von Kohlenmonoxid, eines Katalysators sowie einer Base, umsetzt.

35

40

45





$L^2$  steht für eine Abgangsgruppe wie Halogen, z.B. Chlor, Brom oder Iod, oder Sulfonat wie Mesylat oder Triflat; bevorzugt sind Brom oder Triflat.

Das "Acylierungsprodukt" IV reagiert ggf. direkt zu dem 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazol der Formel I ab.

Als Katalysatoren eignen sich Palladiumligandkomplexe, in denen das Palladium in der Oxidationsstufe 0 vorliegt, metallisches Palladium, das gegebenenfalls auf einen Träger aufgezogen wurde, und vorzugsweise Palladium(II)salze. Die Umsetzung mit Palladium(II)salzen und metallischem Palladium wird vorzugsweise in Gegenwart von Komplexliganden durchgeführt.

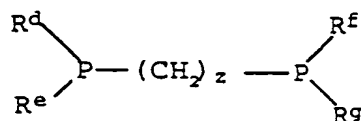
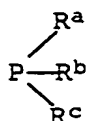
Als Palladium(0)ligandkomplex kommt beispielsweise Tetrakis(triphenylphosphan)palladium in Frage.

Metallisches Palladium ist vorzugsweise auf einen inerten Träger wie beispielsweise Aktivkohle, Siliciumdioxid, Aluminiumoxid, Bariumsulfat oder Calciumcarbonat aufgezogen. Die Reaktion wird vorzugsweise in Gegenwart von Komplexliganden wie beispielsweise Triphenylphosphan durchgeführt.

Als Palladium(II)salze eignen sich beispielsweise Palladiumacetat und Palladiumchlorid. Bevorzugt wird in Gegenwart von Komplexliganden wie beispielsweise Triphenylphosphan gearbeitet.

- 5 Geeignete Komplexliganden für die Palladiumligandkomplexe, bzw. in deren Gegenwart die Umsetzung mit metallischem Palladium oder Palladium(II)salzen vorzugsweise ausgeführt wird, sind tertiäre Phosphane, deren Struktur durch folgende Formeln wiedergegeben wird:

10



- 15 wobei z die Zahlen 1 bis 4 bedeutet und die Reste  $R^a$  bis  $R^g$  für  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Cycloalkyl, Aryl- $C_1$ - $C_2$ -alkyl oder vorzugsweise Aryl stehen. Aryl steht beispielsweise für Naphthyl und gegebenenfalls substituiertes Phenyl wie beispielsweise 2-Tolyl und insbesondere für unsubstituiertes Phenyl.

20

- Die Herstellung der komplexen Palladiumsalze kann in an sich bekannter Weise ausgehend von kommerziell erhältlichen Palladiumsalzen wie Palladiumchlorid oder Palladiumacetat und den entsprechenden Phosphanen wie z.B. Triphenylphosphan oder 1,2-Bis(diphenylphosphano)ethan erfolgen. Ein Großteil der komplexierten Palladiumsalze ist auch kommerziell erhältlich. Bevorzugte Palladiumsalze sind [(R) (+)2,2'-Bis(diphenylphosphano)-1,1'-binaphthyl]palladium(II)chlorid, Bis(triphenylphosphan)palladium(II)acetat und insbesondere Bis(triphenylphosphan)palladium(II)chlorid.

Der Palladiumkatalysator wird in der Regel in einer Konzentration von 0,05 bis 5 Mol%, bevorzugt 1-3 Mol%, eingesetzt.

- 35 Als Basen kommen tertiäre Amine wie beispielsweise N-Methylpiperidin, Ethyldiisopropylamin, 1,8-Bisdimethylaminonaphthalin oder insbesondere Triethylamin in Betracht. Ebenso eignen sich Alkalicarbonat, wie Natriumcarbonat oder Kaliumcarbonat. Aber auch Gemische von Kaliumcarbonat und Triethylamin sind geeignet.

40

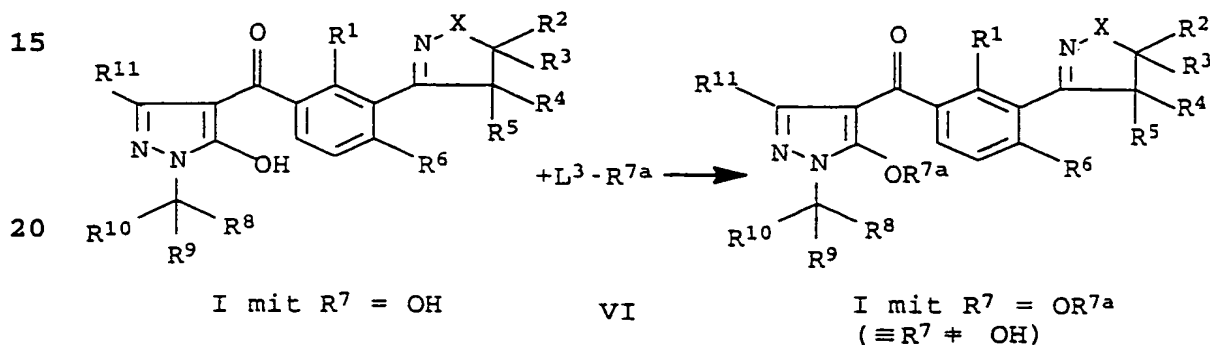
In der Regel werden 2 bis 4 Moläquivalente, insbesondere 2 Moläquivalente, des Alkalicarbonats, sowie 1 bis 4 Moläquivalente, insbesondere 2 Moläquivalente des tertiären Amins bezogen auf das 3-(Heterocylyl)-benzol-Derivate der Formel V eingesetzt.

45

Als Lösungsmittel können Nitrile wie Benzonitril und Acetonitril, Amide wie Dimethylformamid, Dimethylacetamid, Tetra-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylharnstoffe oder N-Methylpyrrolidon und vorzugsweise Ether wie Tetrahydrofuran, Methyl-tert.-butylether dienen. Insbesondere werden Ether wie 1,4-Dioxan und Dimethoxyethan als Lösungsmittel bevorzugt.

#### Verfahren B:

- 10 Verbindungen der Formel I mit R<sup>7</sup> ≠ Hydroxy werden durch Umsetzung von Verbindungen der Formel I mit R<sup>7</sup> = Hydroxy mit Alkylierungsmitteln, Sulfonylierungsmitteln bzw. Acylierungsmitteln L<sup>3</sup>-R<sup>7a</sup> (VI) erhalten.



- 25 L<sup>3</sup> steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, wie Halogen, z.B. Brom oder Chlor, Acyloxy z.B. Acetyloxy, Ethylcarbonyloxy, oder Alkylsulfonyloxy, z.B. Methylsulfonyloxy oder Trifluormethylsulfonyloxy;
- 30 R<sup>7a</sup> steht für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-(Alkylthio)carbonyl, Phenylsulfonyl oder Phenylcarbonyl, wobei der Phenylrest der beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:
- 35 Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;

Die Verbindungen der Formel VI können direkt eingesetzt werden, wie z.B. im Fall der Sulfonsäurehalogenide, Sulfonsäureanhydride oder in situ erzeugt werden, z.B. aktivierte Sulfonsäuren (mittels Sulfonsäure und Dicyclohexylcarbonyldiimid, Carbonyldiimidazol etc.).

Die Ausgangsverbindungen werden in der Regel im äquimolaren Verhältnis eingesetzt. Es kann aber auch von Vorteil sein, die eine oder andere Komponente im Überschuß einzusetzen.

Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Umsetzung in Gegenwart einer Base durchzuführen. Die Reaktanden und die Hilfsbase werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein Überschuß der Hilfsbase z.B. 1,5 bis 3 Moläquivalente, 5 bezogen auf I, kann unter Umständen vorteilhaft sein.

Als Hilfsbasen eignen sich tertiäre Alkylamine, wie Triethylamin, Pyridin, Alkalimetallcarbonate, z.B. Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat und Alkalimetallhydride, z.B. Natriumhydrid. Bevorzugt 10 verwendet werden Triethylamin und Pyridin.

Als Lösungsmittel kommen z.B. chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Chlorbenzol, Ether, wie Diethylether, 15 Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid oder Ester, wie Essigsäureethylester, oder Gemische hiervon in Betracht.

20 In der Regel liegt die Reaktionstemperatur im Bereich von 0°C bis zur Höhe des Siedepunktes des Reaktionsgemisches.

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise zum Produkt hin erfolgen.

25

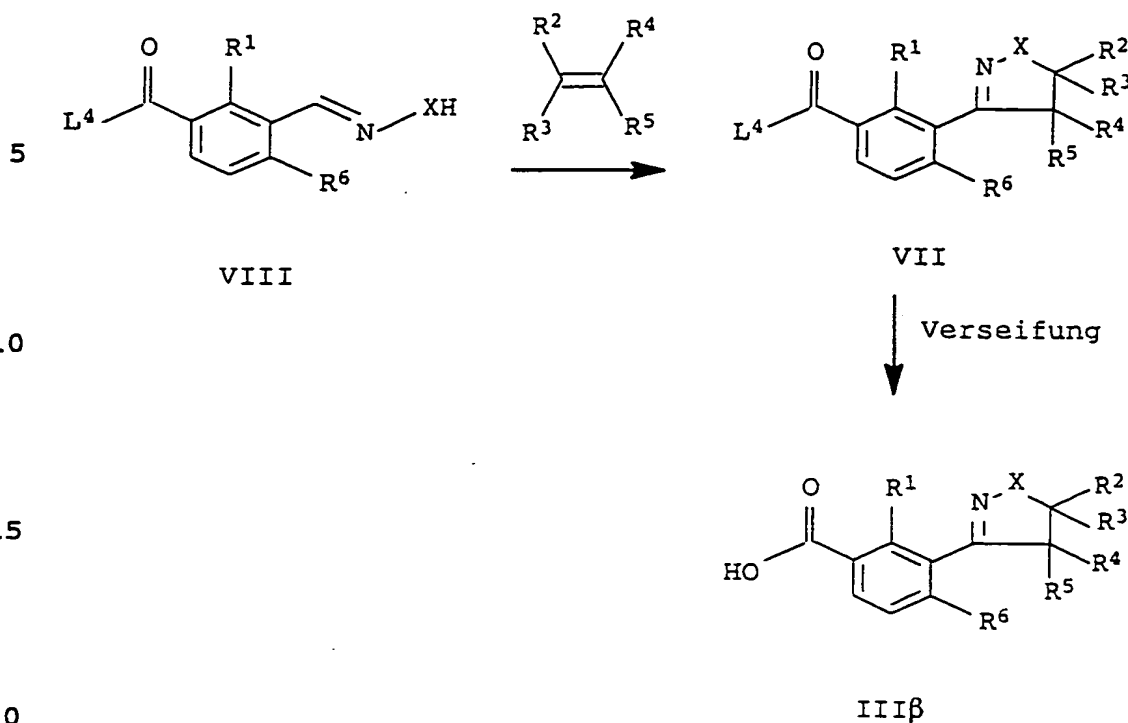
Die als Ausgangsmaterialien verwendeten Pyrazole der Formel II sind bekannt oder können nach an sich bekannten Verfahren hergestellt werden (z.B. EP-A 240 001 und J. Prakt. Chem. 315, 383 (1973)).

30

Die aktivierten Benzoessäuren III $\alpha$  können auf an sich bekannte Art und Weise aus den Benzoessäuren III $\beta$  erhalten werden. Letztere werden wiederum durch Verseifung aus den entsprechenden Estern VII erhalten. Diese können dargestellt werden, indem man ein Oxim 35 bzw. Hydrazon der Formel VIII in das entsprechende Hydroxamsäurehalogenid, insbesondere Hydroxamsäurechlorid, bzw. Carbonsäurehydrazidhalogenid, insbesondere Carbonsäurehydrazidchlorid, überführt; in situ ein Nitriloxid bzw. Nitrilimin erzeugt und dieses mit einem Alken umgesetzt (vgl. z.B. Chem. Ber. 106, 3258-3274 40 (1973)).

45

35



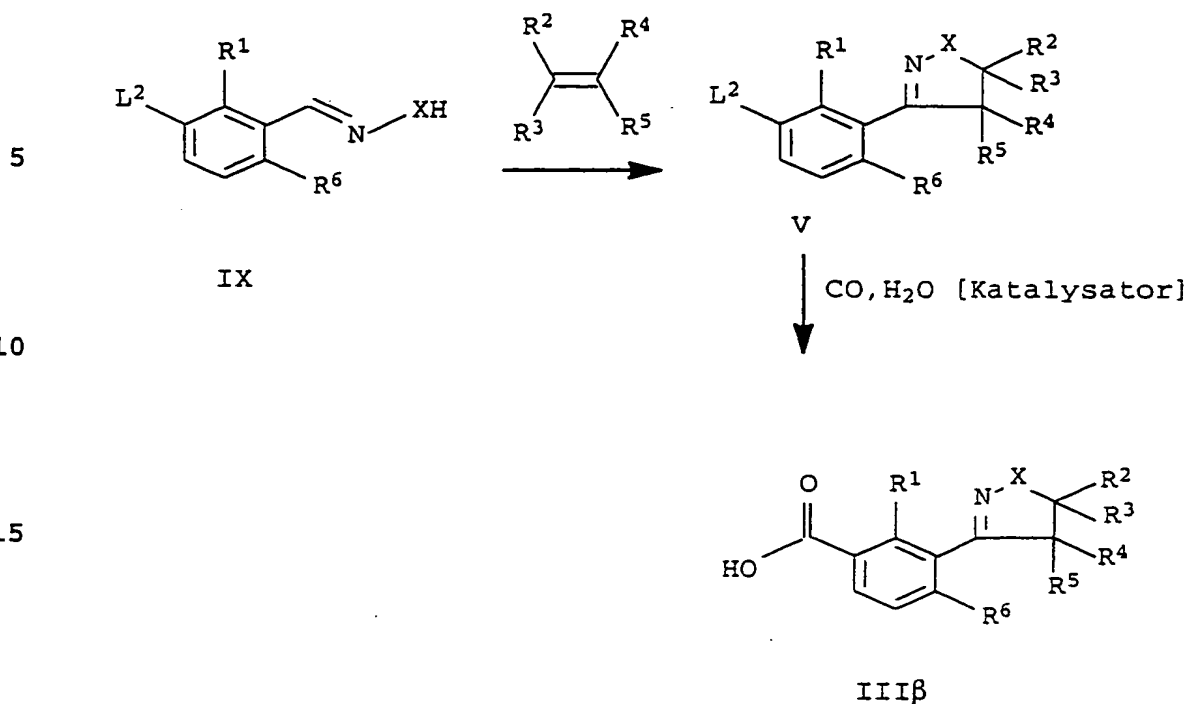
$L^4$  steht für einen  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxyrest.

- 25 Die Benzoesäuren IIIβ können aber auch erhalten werden, indem man ein Oxim bzw. Hydrazin der Formel IX in die entsprechende Nitril-oxide bzw. Nitrilimine überführt und diese mit Alkenen zu den entsprechenden Cycloadditionsprodukten umsetzt (vgl. z.B. Chem. Ber. 106, 3258-3274 (1973)). So wird beispielsweise das Oxim der
- 30 Formel IX ( $X=O$ ) mit Natriumhypochlorit oxidiert und mit einem geeigneten Alken in einem inerten Lösungsmittel, wie Methylenchlorid, Chloroform, Tetrahydrofuran, Dioxan oder Acetonitril, umgesetzt. Dieses wird dann in Gegenwart eines Katalysators sowie einer Base mit Kohlenmonoxid und Wasser in die Benzoesäure IIIβ
- 35 überführt.

40

45

36



20

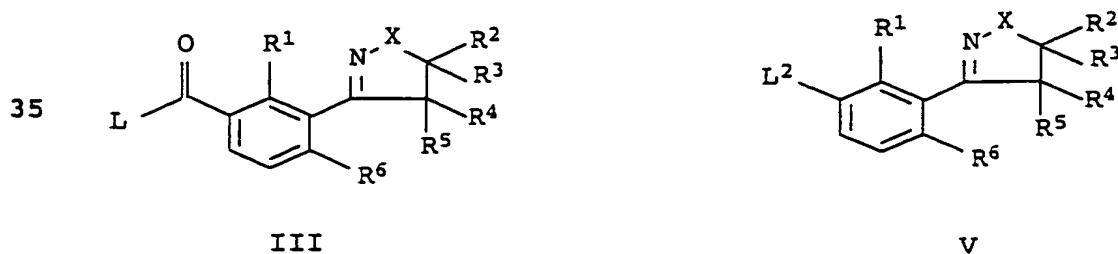
L<sup>2</sup> steht für eine Abgangsgruppe wie Halogen, z.B. Chlor, Brom oder Iod, oder Sulfonat wie Mesylat oder Triflat, bevorzugt sind Brom oder Triflat.

25

Im Hinblick auf die Carbonylierungsreaktion gelten die voranstehenden Ausführungen in Analogie.

Die Verbindungen der Formel III bzw. V sind als solche jeweils

30 neu,



40

wobei jeweils die Variablen R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup> bis R<sup>6</sup> und X die bei den Verbindungen der Formel I angegebene Bedeutung haben und

R<sup>2</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl;

45 L für Hydroxy oder einen abhydrolysierbaren Rest steht;

bzw.

L<sup>2</sup> für eine nukleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht.

5 Beispiele für abhydrolysierbare Reste sind Alkoxy-, Phenoxy-, Alkylthio-, Phenylthio-Reste, die ggf. substituiert sein können, Halogenide, Hetarylreste, die über Stickstoff gebunden sind, Amino-, Imino-Reste, die ggf. substituiert sein können etc.

10 Beispiele für eine nukleophil verdrängbare Abgangsgruppe sind Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyloxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyloxy;

Bevorzugte Verbindungen der Formel III sind diejenigen, wobei L für Halogen, insbesondere Chlor oder Brom bedeutet.

15

Ebenso bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel III, wobei L für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy steht.

Ebenso bevorzugt sind diejenigen Verbindungen der Formel III, wobei L für Hydroxy steht.

20

Die besonders bevorzugten Ausführungsformen der Verbindungen der Formel III bzw. V im Hinblick auf die Variablen X, R<sup>1</sup> und R<sup>3</sup> bis R<sup>6</sup> entsprechen denen der Verbindungen der Formel I.

25

Herstellungsbeispiele

4-[2-Methyl-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoyl]-5-hydroxy-1-(1,1-dimethyl-1-ethyl)-1H-pyrazol

30 (Verbindung 2.1)

Variante 1:

Zu einer Lösung von 1,0 g (3,5 mmol) 2-Methyl-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoesäure in Dioxan wurden 0,61 g (3,5 mmol) 1-(1,1-Dimethyl-1-ethyl)-5-hydroxy-1H-pyrazol und 0,79 g (3,9 mmol) Dicyclohexylcarbodiimid gegeben und bei Raumtemperatur 12 Stunden gerührt. Nach Abtrennen von unlöslichen Bestandteilen wurden 0,58 g (4,2 mmol) Kaliumcarbonat zugegeben und das 3 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Anschließend wurde das Lösungsmittel abdestilliert, der Rückstand in 5%iger Kaliumcarbonat-Lösung aufgenommen, mit Methylenchlorid sowie Toluol gewaschen, mit 10%iger Salzsäure ein pH-Wert von 3 eingestellt und mit Methylenchlorid extrahiert. Diese Methylenchloridlösung wurde getrocknet und das Lösungsmittel entfernt. Man erhielt 0,81 g (57 % der Theorie) 4-[2-Methyl-3-(4,5-dihydroisoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoyl]-5-hydroxy-1-(1,1-dime-

thyl-1-ethyl)-1H-pyrazol]  
Fp. 195-198°C.

Variante 2

5

Zu einer Lösung von 6 g (21,2 mmol) 2-Methyl-3-(4,5-dihydroisoxa-  
zol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoesäure in Toluol wurden 3,78 g  
(32 mmol) Thionylchlorid gegeben und 4 Stunden unter Rückfluß er-  
hitzt. Nach Entfernen des Lösungsmittels wurde der Rückstand in  
10 Dimethoxyethan aufgenommen und eine Lösung von 2,97 g (21,2 mmol)  
1-(1,1-Dimethyl-1-ethyl)-5-hydroxy-1H-pyrazol in Dimethoxyethan  
zugetropft. Anschließend wurde 12 Stunden bei Raumtemperatur ge-  
rührt und 3,5 Stunden unter Rückfluß erhitzt. Das Reaktionsge-  
misch wurde abgekühlt, das Lösungsmittel abdestilliert, der Rück-  
15 stand in 5%iger Kaliumcarbonatlösung aufgenommen und mit Methyl-  
enchlorid gewaschen. Die resultierende wäßrige Phase wurde mit  
Salzsäure auf pH = 1 gestellt und der sich bildende Niederschlag  
abgesaugt. Man erhielt 4,89 g (52 %) 4-[2-Methyl-3-(4,5-dihydro-  
isoxazol-3-yl)-4-methylsulfonylbenzoyl]-5-hydroxy-1-(1,1-di-  
20 methyl-1-ethyl)-1H-pyrazol]  
Fp. 195-198°C.

In Tabelle 2 sind neben der voranstehenden Verbindung noch wei-  
tere 3-(Heterocyclyl)-substituierte Benzoylpyrazole der Formel I  
25 aufgeführt, die in analoger Weise hergestellt wurden oder  
herstellbar sind.

30

35

40

45



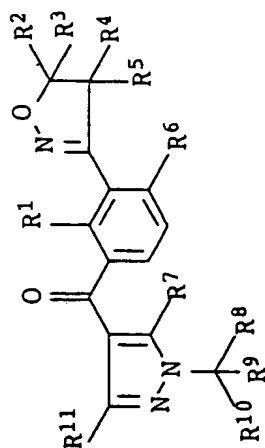


Tabelle 2:

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	physikalische Daten Fp [°C] <sup>1</sup> H-NMR [δ in ppm]
2.1	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	195-198
2.2	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Öl
2.3	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO[3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ]	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	210-211
2.4	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO[3,5-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ]	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	Öl
2.5	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO[2,4-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ]	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	145-148
2.6	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO[3,5-F <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> ]	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	100-105
2.7	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO[3-(CF <sub>3</sub> )-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> ]	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	90-93
2.8	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	198-200
2.9	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	203-205
2.10	CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	75-80
2.11	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	90-95

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	physikalische Daten Fp [°C] <sup>1</sup> H-NMR [δ in ppm]
2.12	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	95-100
2.13	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	80-81
2.14	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	75-84
2.15	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	77-83
2.16	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	120-125
2.17	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	73-79
2.18	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>2</sub> Cl	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OH	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	73-78
2.19	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	Öl
2.20	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	165-170
2.21	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	Öl
2.22	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	Öl
2.23	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCO(3-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	110-115
2.24	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	80-85
2.25	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OSO <sub>2</sub> (4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	95-100
2.26	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOSCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	143-145
2.27	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	228-230

Die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich - sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als Herbizide. Die Verbindungen der Formel I enthaltenden herbiziden Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen der Formel I bzw. sie enthaltenden herbiziden Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera und Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen der Formel I auch in Kulturen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Die Verbindungen der Formel I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder

Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die herbiziden Mittel enthalten eine herbizid wirksame Menge mindestens einer Verbindung der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.

Als inerte Hilfsstoffe kommen im Wesentlichen in Betracht: Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt wie Kerosin und Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffine, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline und deren Derivate, alkylierte Benzole und deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol und Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon und Wasser.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe (Adjuvantien) kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanole sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat,

Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder  
5 gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe her-  
10 gestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat,  
15 Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Konzentrationen der Verbindungen der Formel I in den  
20 anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Im allgemeinen enthalten die Formulierungen etwa von 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindestens eines Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100%  
25 (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Die folgenden Formulierungsbeispiele verdeutlichen die Herstellung solcher Zubereitungen:

- 30 I. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 2.8 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure  
35 und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 40 II. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 2.9 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctyl-  
45 phenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichts-

teilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

- 5 III. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 2.3 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung  
10 in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 15 IV. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 2.3 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalinsulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichts-  
20 teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- V. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 2.9 werden mit  
25 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 30 VI. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 2.8 werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkoholpolyglykolether, 2 Gewichts-  
teilen Natrium Salz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.
- 35 VII. 1 Gewichtsteil des Wirkstoffs Nr. 2.3 wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und  
40 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- 45 VIII. 1 Gewichtsteil des Wirkstoffs Nr. 2.9 wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wettol® EM 31 (= nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusöl) besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

Die Applikation der Verbindungen der Formel I bzw. der herbiziden Mittel kann im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei

5 welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

10

Die Aufwandmengen an Verbindung der Formel I betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0, vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

15

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt

20 und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryloxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoessäure und deren Derivate, Benzothiadiazinone, 2-(Heteroaryl/Aroyl)-1,3-cyclohexandione, Heteroaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, meta-CF<sub>3</sub>-Phenyl-derivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexanonoximether-derivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, 25 Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydrophthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, Phenylessigsäure und deren Derivate, 2-Phenylpropionsäure und 35 deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridin-carbonsäure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazol-carboxamide und Uracile in Betracht.

40 Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen der Formel I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner 45 die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von

Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

#### Anwendungsbeispiele

5

Die herbizide Wirkung der 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I ließ sich durch die folgenden Gewächshausversuche zeigen:

- 10 Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

- Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder  
15 emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Test-  
20 pflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

- Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm  
25 angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wurden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt.  
30 Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 0,5, 0,25, 0,125 bzw. 0,0625 kg/ha a.S. (aktive Substanz).

- Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 bis 25°C bzw. 20 bis 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte  
35 sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

- Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100  
40 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.



Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

	Lateinischer Name	Deutscher Name	Englischer Name
5	<i>Abutilon theophrasti</i>	Chinesischer Hanf	velvet leaf
	<i>Amaranthus retroflexus</i>	Fuchsschwanz	pig weed
	<i>Avena fatua</i>	Flughafer	wild oat
	<i>Chenopodium album</i>	Weißer Gänsefuß	lambsquarters
10	<i>Echinochloa crus galli</i>	Hühnerhirse	barnyardgrass
	<i>Polygonum persicaria</i>	Flohknöterich	ladysthumb
	<i>Setaria faberi</i>	Große Borstenhirse	giant foxtail
	<i>Setaria viridis</i>	Grüne Borstenhirse	green foxtail
15	<i>Sinapis alba</i>	Weißer Senf	white mustard
	<i>Solanum nigrum</i>	Schwarzer Nachtschatten	black nightshade

Bei Aufwandmengen von 0,125 bzw. 0,0625 kg/ha zeigte die Verbindung 2.3 (Tabelle 2) im Nachauflauf eine sehr gute Wirkung gegen die unerwünschten Pflanzen Hühnerhirse, Fuchsschwanz, weißer Gänsefuß, Flohknöterich und schwarzer Nachtschatten.

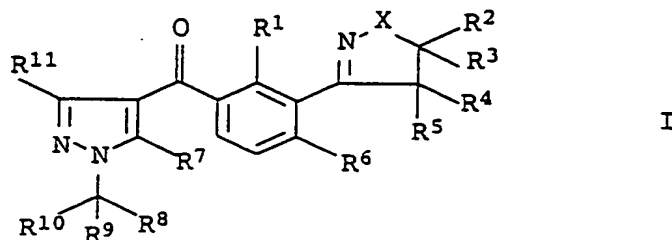
Weiterhin bekämpfte Verbindung 2.8 (Tabelle 2) im Nachauflauf bei Aufwandsmengen von 0,5 bzw. 0,25 kg/ha die Schadpflanzen Hühnerhirse, grüne Borstenhirse, weißer Gänsefuß und schwarzer Nachtschatten sehr gut.

Die Wirkung von Verbindung 2.9 (Tabelle 2) im Nachauflauf bei Aufwandsmengen von 0,25 bzw. 0,125 kg/ha auf die Gräser Flughafer und grüne Borstenhirse sowie auf die Unkräuter Fuchsschwanz, Flohknöterich und weißer Senf ist sehr gut.

Ebenso bekämpft die Verbindung 2.10 (Tabelle 2) bei Aufwandsmengen von 0,25 bzw. 0,125 kg/ha im Nachauflauf die unerwünschten Pflanzen Hühnerhirse, weißer Gänsefuß, weißer Senf und schwarzer Nachtschatten sehr gut.

## Patentansprüche

1. 3-(Heterocyclyl)-substituierte Benzoylpyrazole der Formel I



in der die Variablen folgende Bedeutung haben:

X O, NH oder N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl);

R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl;

R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl;

R<sup>6</sup> Halogen, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl;

R<sup>7</sup> Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-(Alkylthio)carbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest der beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;

R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

R<sup>10</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;  
wobei die Anzahl der Kohlenstoffatome der Reste R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> zusammen maximal 7 beträgt,

R<sup>11</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze.

2. 3-(Heterocyclyl)-substituierte Benzoylpyrazole der Formel I nach Anspruch 1, wobei

X O;

R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

R<sup>6</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl;

bedeuten.

3. 3-(Heterocyclyl)-substituierte Benzoylpyrazole der Formel I nach Anspruch 1, wobei

X O;

R<sup>1</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl;

R<sup>6</sup> Halogen, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;

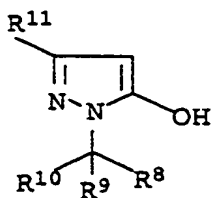
bedeuten.

4. 3-(Heterocyclyl)-substituierte Benzoylpyrazole der Formel I nach Anspruch 1, wobei

X N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl);

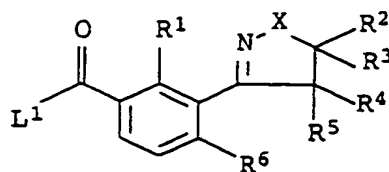
bedeutet.

5. Verfahren zur Darstellung von 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazolen der Formel I mit R<sup>7</sup>=Hydroxy, nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Pyrazol der Formel II

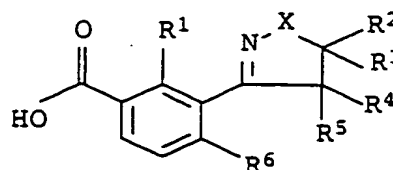


II

mit einer aktivierten Benzoesäure IIIa oder einer Benzoesäure IIIb,



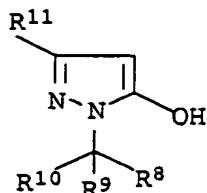
IIIα



IIIβ

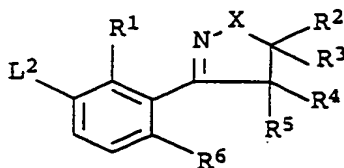
wobei die Variablen X, R<sup>1</sup> bis R<sup>6</sup> und R<sup>8</sup> bis R<sup>11</sup> die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und L<sup>1</sup> für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, acyliert und Acylierungsprodukt ggf. in Gegenwart eines Katalysators zu den Verbindungen der Formel I mit R<sup>7</sup> = Hydroxy umlagert.

6. Verfahren zur Herstellung von 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazolen der Formel I mit R<sup>7</sup> = OH, nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Pyrazol der Formel II,



II

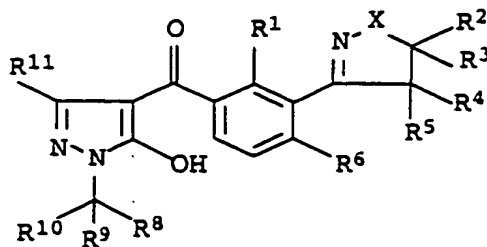
in der die Variablen R<sup>8</sup> bis R<sup>11</sup> die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben, oder ein Alkalisalz hiervon, mit einem 3-(Heterocyclyl)-benzol-Derivat der Formel V,



V

wobei die Variablen X und R<sup>1</sup> bis R<sup>6</sup> die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und L<sup>2</sup> für eine Abgangsgruppe steht in Gegenwart von Kohlenmonoxid, eines Katalysators sowie einer Base umgesetzt.

7. Verfahren zur Herstellung von 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazolen der Formel I mit R<sup>7</sup> ≠ Hydroxy, nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein 3-(Heterocyclyl)-substituiertes Benzoylpyrazol I mit R<sup>7</sup> = Hydroxy,

I mit R<sup>7</sup> = OH

51

mit einer Verbindung der Formel VI



5 umgesetzt, wobei

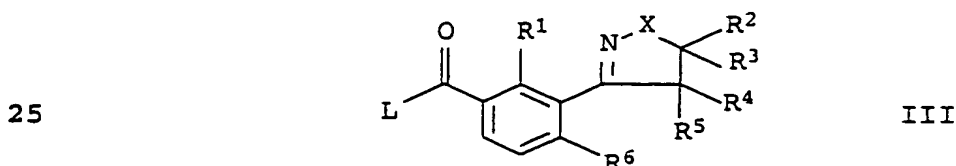
$L^3$  eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe;

10  $R^{7a}$   $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_3$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylsulfonyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_4$ -(Alkylthio)carbonyloxy, Phenylsulfonyl oder Phenylcarbonyl, wobei der Phenylrest der beiden letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig

15 halogeniert sein kann und/oder eine bis drei der folgenden Gruppen tragen kann:  
Nitro, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy;

bedeuten.

20 8. Benzoessäureester der Formel III,



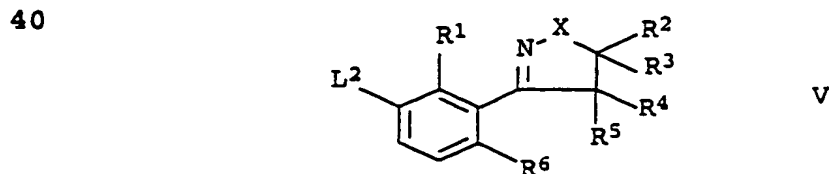
30 wobei die Variablen X,  $R^1$  und  $R^3$  bis  $R^6$  die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und

$R^2$   $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl; und

L Hydroxy oder abhydrolysierbarer Rest;

35 bedeuten.

9. 3-(Heterocyclyl)-benzol-Derivate der Formel V,



45 wobei die Variablen X,  $R^1$  und  $R^3$  bis  $R^6$  die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und

R<sup>2</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl; und

L<sup>2</sup> nukleophil verdrängbare Abgangsgruppe;

5 bedeuten.

10. Mittel, enthaltend eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazols der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 4, und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel.
11. Verfahren zur Herstellung von Mitteln gemäß Anspruch 8, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazols der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 4 und für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln übliche Hilfsmittel mischt.
12. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazols der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß den Ansprüchen 1 bis 4, auf Pflanzen, deren Lebensraum und/oder auf Samen einwirken läßt.
13. Verwendung der 3-(Heterocyclyl)-substituierten Benzoylpyrazole der Formel I und/oder deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze gemäß den Ansprüchen 1 bis 4 als Herbizide.

02:0050/050555  
030106

PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales BüroINTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation <sup>7</sup> : C07D 413/10, 231/20, A01N 43/74, 43/50		A3	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 00/34273
			(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 15. Juni 2000 (15.06.00)
(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP99/09413			
(22) Internationales Anmeldedatum: 2. Dezember 1999 (02.12.99)			
(30) Prioritätsdaten: 198 55 850.3 4. Dezember 1998 (04.12.98) DE 199 36 514.8 6. August 1999 (06.08.99) DE			
(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AK- TIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE).		(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE).	
(72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): NEIDLEIN, Ulf [DE/DE]; Brahmsstrasse 3, D-68165 Mannheim (DE); GÖTZ, Nor- bert [DE/DE]; Schöfferstrasse 25, D-67547 Worms (DE); BAUMANN, Ernst [DE/DE]; Falkenstrasse 6a, D-67373 Dudenhofen (DE); VON DEYN, Wolfgang [DE/DE]; An der Bleiche 24, D-67435 Neustadt (DE); KUDIS, Steffen [DE/DE]; Spelzenstrasse 10, D-68167 Mannheim (DE); LANGEMANN, Klaus [DE/DE]; Goldbergstrasse 18, D-67551 Worms (DE); MAYER, Guido [DE/DE]; Gurleuthausstrasse 8, D-67433 Neustadt (DE); MISSLITZ, Ulf [DE/DE]; Mandelring 74, D-67433 Neustadt (DE); WITSCHEL, Matthias [DE/DE]; Wittelsbachstrasse 81, D-67061 Ludwigshafen (DE); OTTEN, Martina [DE/DE];		(81) Bestimmungsstaaten: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).	
		Veröffentlicht Mit internationalem Recherchenbericht.	
		(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenbe- richts: 2. November 2000 (02.11.00)	
(54) Title: 3-(HETEROCYCLYL)-SUBSTITUTED BENZOYLPYRAZOLS			
(54) Bezeichnung: 3-(HETEROCYCLYL)-SUBSTITUIERTE BENZOYLPYRAZOLE			
<p style="text-align: right;">(I)</p>			
(57) Abstract			
<p>The invention relates to 3-(heterocyclyl)-substituted benzoylpyrazols of formula (I), wherein the variables have the following meanings: X is O, NH or N-alkyl; R<sup>1</sup> is alkyl; R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> are hydrogen, alkyl or alkyl halide; R<sup>6</sup> is halogen, nitro, alkyl halide, alkoxy, halogenalkoxy, alkylthio, halogenalkylthio, alkylsulfonyl or halogenalkylsulfonyl; R<sup>7</sup> is hydroxy, alkoxy, alkenyloxy, alkylsulfonyloxy, alkylcarbonyloxy, alkylthiocarbonyloxy, phenylsulfonyloxy or phenylcarbonyloxy, and the phenyl radical can be substituted; R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> are alkyl; R<sup>10</sup> is hydrogen or alkyl; and R<sup>11</sup> is hydrogen or alkyl; and to their agriculturally useable salts. The invention also relates to intermediate products and methods for producing the inventive compounds and to the use of these compounds or products containing them for combating undesirable plants.</p>			
(57) Zusammenfassung			
<p>Die Erfindung betrifft 3-(Heterocyclyl)-substituierte Benzoylpyrazole der Formel (I), in der die Variablen folgende Bedeutung haben: X O, NH oder N-Alkyl; R<sup>1</sup> Alkyl; R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl; R<sup>6</sup> Halogen, Nitro, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkylsulfonyl oder Halogenalkylsulfonyl; R<sup>7</sup> Hydroxy, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkylsulfonyloxy, Alkylcarbonyloxy, Alkylthiocarbonyloxy, Phenylsulfonyloxy oder Phenylcarbonyloxy, wobei der Phenylrest substituiert sein kann; R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> Alkyl; R<sup>10</sup> Wasserstoff oder Alkyl; R<sup>11</sup> Wasserstoff oder Alkyl; sowie deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze. Zwischenprodukte und Verfahren zu ihrer Herstellung; sowie die Verwendung dieser Verbindungen oder diese enthaltende Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Pflanzen.</p>			

He

### LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
EE	Estland						



# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/EP 99/09413

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 C07D413/10 C07D231/20 A01N43/74 A01N43/50

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, PAJ

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 96 26206 A (BASF AG ;DEYN WOLFGANG VON (DE); HILL REGINA LUISE (DE); KARDORFF) 29 August 1996 (1996-08-29) cited in the application abstract; claims page 39 -page 40; examples; table 5	1,8,10, 11
X	WO 98 31681 A (BASF AG) 23 July 1998 (1998-07-23) cited in the application abstract; claims page 120 -page 129; examples; table 3	1,8,10, 11
X	& WO 98 31682 A (BASF AG) 23 July 1998 (1998-07-23) examples	1,8,10, 11
	---	
	-/--	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

### \* Special categories of cited documents :

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

14 August 2000

Date of mailing of the international search report

25/08/2000

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Paisdor, B

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 99/09413

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P, X	<p>WO 99 23094 A (TAKAHASHI AKIHIRO ;ADACHI HIROYUKI (JP); KOGUCHI MASAMI (JP); NIPP)  14 May 1999 (1999-05-14)  abstract  page 21 -page 23; table  page 24 -page 28  page 29 -page 35; tables  -----</p>	<p>1,8,10,  11</p>

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 99/09413

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9626206	A	29-08-1996	AU 710172 B	16-09-1999
			AU 4665596 A	11-09-1996
			BG 101825 A	30-04-1998
			BR 9607333 A	25-11-1997
			CA 2210693 A	29-08-1996
			CN 1175951 A	11-03-1998
			CZ 9702473 A	13-05-1998
			EP 0811007 A	10-12-1997
			FI 973471 A	22-08-1997
			HU 9800725 A	28-07-1998
			JP 11500438 T	12-01-1999
			LT 97145 A, B	26-01-1998
			LV 11895 A	20-12-1997
			LV 11895 B	20-03-1998
			NO 973861 A	22-10-1997
			NZ 301272 A	25-02-1999
			PL 322277 A	19-01-1998
			SK 104297 A	08-07-1998
			US 5846907 A	08-12-1998
WO 9831681	A	23-07-1998	AU 6092998 A	07-08-1998
			AU 6207698 A	07-08-1998
			AU 6613398 A	07-08-1998
			CN 1248255 T	22-03-2000
			CN 1250447 T	12-04-2000
			WO 9831676 A	23-07-1998
			WO 9831682 A	23-07-1998
			EP 0966452 A	29-12-1999
			EP 0958291 A	24-11-1999
			EP 0958292 A	24-11-1999
			NO 993521 A	15-09-1999
			NO 993522 A	16-09-1999
			PL 334847 A	27-03-2000
			PL 334849 A	27-03-2000
			SK 90399 A	10-12-1999
			SK 91999 A	18-01-2000
WO 9923094	A	14-05-1999	AU 9650598 A	24-05-1999
			JP 11240872 A	07-09-1999

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/09413

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
IPK 7 C07D413/10 C07D231/20 A01N43/74 A01N43/50

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, WPI Data, PAJ

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 96 26206 A (BASF AG ; DEYN WOLFGANG VON (DE); HILL REGINA LUISE (DE); KARDORFF) 29. August 1996 (1996-08-29) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche Seite 39 -Seite 40; Beispiele; Tabelle 5	1,8,10, 11
X	WO 98 31681 A (BASF AG) 23. Juli 1998 (1998-07-23) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Ansprüche Seite 120 -Seite 129; Beispiele; Tabelle 3	1,8,10, 11
X	& WO 98 31682 A (BASF AG) 23. Juli 1998 (1998-07-23) Beispiele	1,8,10, 11
	---	
	-/-	

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

- \* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
- \* A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- \* E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- \* L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- \* O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- \* P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

- \* T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- \* X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- \* Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- \* G\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

14. August 2000

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

25/08/2000

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Paisdor, B

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/09413

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P, X	<p>WO 99 23094 A (TAKAHASHI AKIHIRO ; ADACHI HIROYUKI (JP); KOGUCHI MASAMI (JP); NIPP)</p> <p>14. Mai 1999 (1999-05-14)</p> <p>Zusammenfassung</p> <p>Seite 21 -Seite 23; Tabelle</p> <p>Seite 24 -Seite 28</p> <p>Seite 29 -Seite 35; Tabellen</p> <p>-----</p>	<p>1, 8, 10,</p> <p>11</p>

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/09413

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9626206 A	29-08-1996	AU 710172 B	16-09-1999
		AU 4665596 A	11-09-1996
		BG 101825 A	30-04-1998
		BR 9607333 A	25-11-1997
		CA 2210693 A	29-08-1996
		CN 1175951 A	11-03-1998
		CZ 9702473 A	13-05-1998
		EP 0811007 A	10-12-1997
		FI 973471 A	22-08-1997
		HU 9800725 A	28-07-1998
		JP 11500438 T	12-01-1999
		LT 97145 A,B	26-01-1998
		LV 11895 A	20-12-1997
		LV 11895 B	20-03-1998
		NO 973861 A	22-10-1997
		NZ 301272 A	25-02-1999
		PL 322277 A	19-01-1998
		SK 104297 A	08-07-1998
		US 5846907 A	08-12-1998
WO 9831681 A	23-07-1998	AU 6092998 A	07-08-1998
		AU 6207698 A	07-08-1998
		AU 6613398 A	07-08-1998
		CN 1248255 T	22-03-2000
		CN 1250447 T	12-04-2000
		WO 9831676 A	23-07-1998
		WO 9831682 A	23-07-1998
		EP 0966452 A	29-12-1999
		EP 0958291 A	24-11-1999
		EP 0958292 A	24-11-1999
		NO 993521 A	15-09-1999
		NO 993522 A	16-09-1999
		PL 334847 A	27-03-2000
		PL 334849 A	27-03-2000
		SK 90399 A	10-12-1999
		SK 91999 A	18-01-2000
WO 9923094 A	14-05-1999	AU 9650598 A	24-05-1999
		JP 11240872 A	07-09-1999